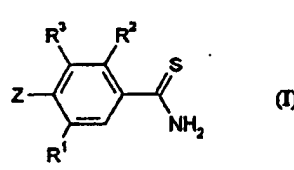




PCT
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationales Büro
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 249/10, A01N 43/00, C07D 471/04, 239/54, 239/56, 207/452, 209/48, 211/88, 231/56, 487/04		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 95/30661
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. November 1995 (16.11.95)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP95/01507		(DE). DOLLINGER, Markus [DE/DE]; Burscheider Strasse 154b, D-51381 Leverkusen (DE).	
(22) Internationales Anmeldedatum: 21. April 1995 (21.04.95)		(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER AKTIENGESELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).	
(30) Prioritätsdaten: P 44 15 655.3 4. Mai 1994 (04.05.94) DE 195 00 439.6 10. Januar 1995 (10.01.95) DE		(81) Bestimmungsstaaten: AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, FI, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, UA, US, europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).			
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): LINKER, Karl-Heinz [DE/DE]; Albert-Schweitzer-Strasse 3, D-51377 Leverkusen (DE). FINDEISEN, Kurt [DE/DE]; Dünfelder Strasse 28, D-51375 Leverkusen (DE). ANDREE, Roland [DE/DE]; Dechant-Miebach-Weg 37, D-40764 Langenfeld (DE). DREWES, Mark-Wilhelm [ZA/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). LENDER, Andreas [DE/DE]; Lüneburger Strasse 15, D-21376 Salzhausen (DE). SCHALLNER, Otto [DE/DE]; Noldeweg 22, D-40789 Monheim (DE). HAAS, Wilhelm [DE/DE]; Schürgespfad 19, D-50259 Pulheim (DE). SANTEL, Hans-Joachim [DE/DE]; Grünstrasse 9a, D-51371 Leverkusen		Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht.	
(54) Title: SUBSTITUTED AROMATIC THIOCARBOXYLIC ACID AMIDES AND THEIR USE AS HERBICIDES			
(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE AROMATISCHE THIOCARBONSÄUREAMIDE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE			
 <p>(I)</p>			
(57) Abstract			
<p>The invention relates to novel substituted aromatic thiocarboxylic acid amides of general formula (I) in which R¹, R² and R³ are hydrogen or various substituents and Z is possibly substituted monocyclic or bicyclic, saturated or unsaturated heterocyclyl, heterocyclyl amino or heterocyclyl imino, and their use as herbicides.</p>			
(57) Zusammenfassung			
<p>Die Erfindung betrifft neue substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I), in welcher R¹, R², R³ für Wasserstoff oder verschiedene Substituenten stehen und Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino steht, sowie ihre Verwendung als Herbizide.</p>			

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AT	Österreich	GA	Gabon	MR	Mauretanien
AU	Australien	GB	Vereinigtes Königreich	MW	Malawi
BB	Barbados	GE	Georgien	NE	Niger
BE	Belgien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	NZ	Neuseeland
BJ	Benin	IE	Irland	PL	Polen
BR	Brasilien	IT	Italien	PT	Portugal
BY	Belarus	JP	Japan	RO	Rumänien
CA	Kanada	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CG	Kongo	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CH	Schweiz	KR	Republik Korea	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kasachstan	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LI	Liechtenstein	SN	Senegal
CN	China	LK	Sri Lanka	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dänemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanien	MG	Madagaskar	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	ML	Mali	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MN	Mongolei	VN	Vietnam

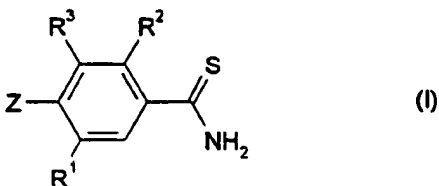
- 1 -

SUBSTITUIERTE AROMATISCHE THIOCARBONSÄUREAMIDE UND IHRE VERWENDUNG ALS HERBIZIDE

- 5 Die Erfindung betrifft neue substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bereits bekannt, daß bestimmte aromatische Carbothioamide, wie z.B. 2,6-Dichlor-benzothioamid ("Chlorthiamid") herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. GB-PS 987253). Die Wirksamkeit dieser vorbekannten Verbindung ist jedoch, insbe-
 10 sondere bei niedrigen Aufwandmengen und Konzentrationen nicht in allen Anwendungsgebieten völlig zufriedenstellend.

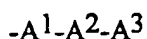
Es wurden nun die neuen substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) gefunden,



- 15 in welcher

R¹ für Wasserstoff oder Halogen steht,

R² für die nachstehende Gruppierung steht,



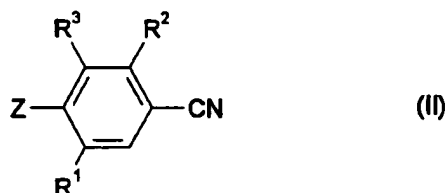
worin

- 5 A^1 für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Aryl, Alkylsulfonyl oder Arylsulfonyl steht,
- 10 A^1 weiterhin für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Alkendiyl, Alkindiyl, Cycloalkandiyl, Cycloalkendiyl oder Arendiyl steht,
- 15 A^2 für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Aryl, Alkoxy, Alkylsulfonyl oder Arylsulfonyl steht,
- 20 A^2 weiterhin für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Alkendiyl, Alkindiyl, Cycloalkandiyl, Cycloalkendiyl oder Arendiyl steht,
- 15 A^3 für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Isocyano, Thiocyanato, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Sulfo, Chlorsulfonyl, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkoxycarbonyl, Dialkoxy(thio)phosphoryl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenylamino, Alkylidenamino, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy, Alkynylamino, Alkynyloxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylidenamino, Cycloalkyloxycarbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Aryl, Aryloxy, Arylalkyl, Arylalkoxy, Aryloxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylalkoxy oder Heterocyclylalkoxycarbonyl steht,
- 25 R^3 für Wasserstoff, Halogen oder zusammen mit R^2 für eine Alkandiyl- oder eine Alkendiyl-Gruppierung steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO₂-Gruppierung, eine NH-Gruppierung, eine N-Alkyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält, und

- 3 -

Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocycl, Heterocyclamino oder Heterocyclimino steht.

Man erhält die neuen substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I), wenn man substituierte aromatische Nitrile der allgemeinen Formel (II)



in welcher

R¹, R², R³ und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 mit Schwefelwasserstoff (Hydrosulfid, H₂S) oder mit Thioacetamid gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

Die neuen substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke und selektive herbizide Wirksamkeit aus.

15 In den Definitionen sind die gesättigten oder ungesättigten Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkandyl, Alkenyl oder Alkynyl - auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie in Alkoxy, Alkylthio oder Alkylamino - jeweils geradkettig oder verzweigt.

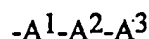
Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

20 Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I), in welcher

R¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Brom steht,

- 4 -

R² für die nachstehende Gruppierung steht,



in welcher

5 A¹ für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,

10 A¹ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl, C₂-C₆-Alkindiyl, C₃-C₆-Cycloalkandiyl, C₃-C₆-Cycloalkendiyl oder Phenylen steht,

A² für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,

15 A² weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl, C₂-C₆-Alkindiyl, C₃-C₆-Cycloalkandiyl, C₃-C₆-Cycloalkendiyl oder Phenylen steht,

20 A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Isocyano, Thiocyanato, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Sulfo, Chlorsulfonyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Di-alkylamino, Alkoxycarbonyl oder Dialkoxy(thio)phosphoryl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenylamino, 25 Alkylidenamino, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkinyloxy, Alkynylamino oder Alkinyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl-, Alkyliden- oder Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Carboxy, C₁-C₄-Alkyl und/oder C₁-C₄-Alkoxy-

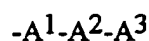
- carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylidenamino, Cycloalkyloxycarbonyl oder Cycloalkylalkoxycarbonyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyloxy und/oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Phenyl, Phenyloxy, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenyloxy-carbonyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxycarbonyl, (jeweils gegebenenfalls ganz oder teilweise hydriertes) Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Furyl, Thienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Pyrazolyl-C₁-C₄-alkyl, Furyl-C₁-C₄-alkyl, Thienyl-C₁-C₄-alkyl, Oxazolyl-C₁-C₄-alkyl, Isoxazol-C₁-C₄-alkyl, Thiazol-C₁-C₄-alkyl, Pyridinyl-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidinyl-C₁-C₄-alkyl, Pyrazolylmethoxy, Furylmethoxy, für Perhydropyranylmethoxy oder Pyridylmethoxy steht,
- R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder zusammen mit R² für eine Alkandiyl oder Alkendiyl-Gruppierung mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO₂-Gruppierung, eine NH-Gruppierung, eine N-C₁-C₄-Alkyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält, und
- Z für jeweils monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 4 Stickstoffatomen im heterocyclischen Ringsystem steht, welches gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und/oder gegebenenfalls bis zu drei Gruppierungen aus der Reihe -CO-, -CS-, -SO- und/oder SO₂- enthält, und welches gegebenenfalls substituiert ist durch eine oder mehrere Gruppierungen aus der Reihe Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₆-Alkyl (welches gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist), C₂-C₆-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl (welche jeweils gegebenenfalls durch

Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sind), C₂-C₆-Alkenyloxy oder C₂-C₆-Alkinyloxy (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkylthio, C₂-C₆-Alkenylthio oder C₂-C₆-Alkinylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkylamino oder Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sind), Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl oder Phenylamino (welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyloxy und/oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind).

Gegenstand der Erfindung sind insbesondere Verbindungen der Formel (I), in welcher

R¹ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

15 R² für die nachstehende Gruppierung steht,



in welcher

20 A¹ für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht,

A¹ weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl, Propin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,

25 A² für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy,

- 7 -

Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,

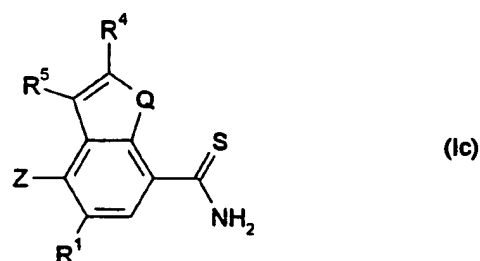
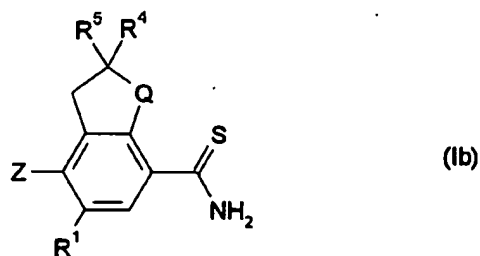
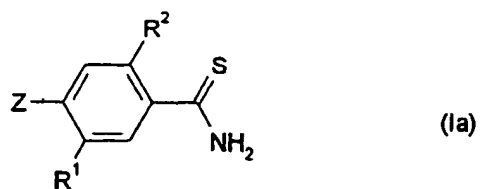
- 5 A² weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl, Propin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,
- 10 A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Sulfo, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, n-, i-, s- oder t-Pentyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Dimethoxyphosphoryl, Diethoxyphosphoryl, Dipropoxyphosphoryl oder Diisopropoxyphosphoryl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylamino, Butenylamino, Propylidenamino, Butylidenamino, Propenyloxy-carbonyl, Butenyloxy-carbonyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinylamino, Butinylamino, Propinyloxy-carbonyl oder Butinyloxy-carbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopentylidenamino, Cyclohexylidenamino, Cyclopentyloxy-carbonyl, Cyclohexyloxy-carbonyl, Cyclopentylmethoxycarbonyl oder Cyclohexylmethoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Tri-
- 15
- 20
- 25
- 30

- fluormethoxy, Methoxycarbonyl und/oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenyl, Phenylloxy, Benzyl, Phenylethyl, Benzyloxy, Phenylloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, (jeweils gegebenenfalls ganz oder teilweise hydriertes) Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Furyl, Thienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Pyrazolylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolmethyl, Thiazolmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyrazolylmethoxy, Furylmethoxy oder Pyridylmethoxy steht,
- 5
- 10 R^3 für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder zusammen mit R^2 für eine Alkandiyld- oder Alkendiyl-Gruppierung mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine NH-Gruppierung, eine N-Methyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält,
- 15 und
- Z für jeweils monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Stickstoffatomen im heterocyclischen Ringsystem steht, welches gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und/oder gegebenenfalls bis zu zwei Gruppierungen aus der Reihe -CO-, -CS-, -SO- und/oder SO₂- enthält, und welches gegebenenfalls substituiert ist
- 20 durch eine oder mehrere Gruppierungen aus der Reihe Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom; Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, (welche gegebenenfalls
- 25 durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiert sind); Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiert sind);
- 30 Propenylloxy, Butenylloxy, Propinylloxy oder Butinylloxy (welche gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio

oder Butinylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiert sind), Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl oder Phenylamino (welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiert sind).

Als ganz besonders bevorzugte Gruppen von Verbindungen der Formel (I) seien die nachstehend skizzierten Verbindungen der Formeln (Ia), (Ib) und (Ic) genannt,

- 10 -



wobei

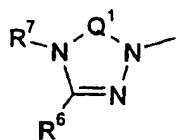
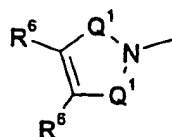
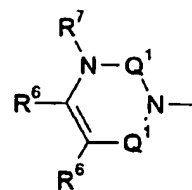
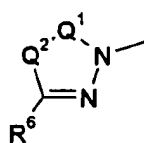
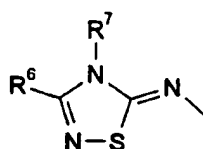
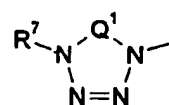
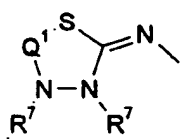
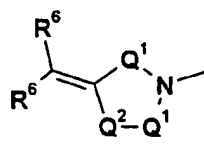
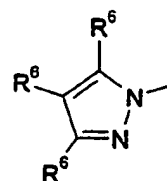
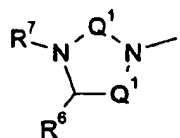
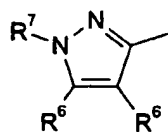
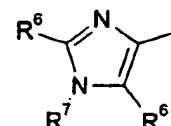
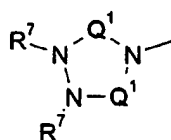
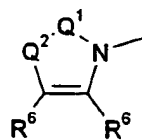
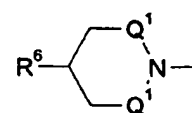
R^1 , R^2 und Z die oben als insbesondere bevorzugt angegebenen Bedeutungen haben,

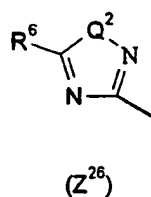
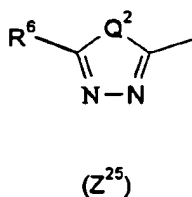
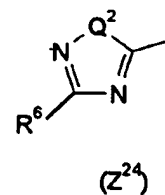
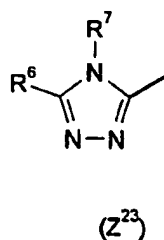
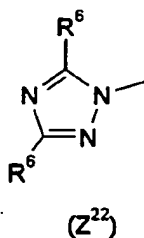
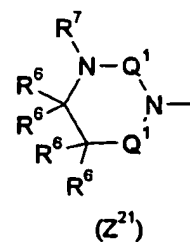
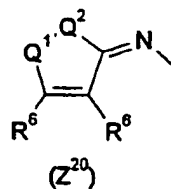
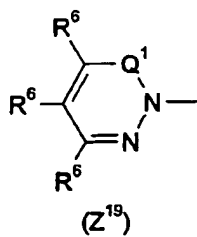
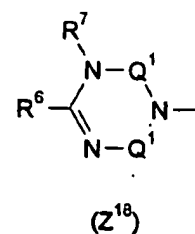
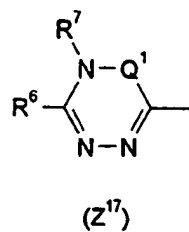
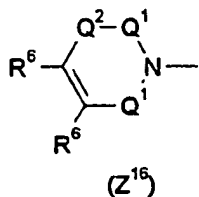
R^4 und R^5 gleich oder verschieden sind und unabhängig voneinander jeweils einzeln
 5 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl stehen - oder in der Formel
 (Ib) auch zusammen für Sauerstoff oder Schwefel stehen können - sowie

Q für Sauerstoff, Schwefel, N-Methyl oder N-Ethyl steht.

Z steht in den allgemeinen Formeln (I) sowie ((Ia), (Ib) und (Ic) insbesondere für die
 nachstehend aufgeführten heterocyclischen Gruppierungen,

- 11 -

(Z¹)(Z²)(Z³)(Z⁴)(Z⁵)(Z⁶)(Z⁷)(Z⁸)(Z⁹)(Z¹⁰)(Z¹¹)(Z¹²)(Z¹³)(Z¹⁴)(Z¹⁵)



5 wobei jeweils

Q¹ für eine Gruppierung aus der Reihe -CO-, -CS-, -CH₂-, -CH(OH)-, -CHCl-, -CHBr-, -C(=CH₂)-, -C(=CHF)-, -C(=CF₂)-, -C(=CHCl)-, -C(=CHBr)-, -C(=CHOCHF₂)-, -C(=CHOCHF₃)-, -C(=CHOCH₂CF₃)- steht,

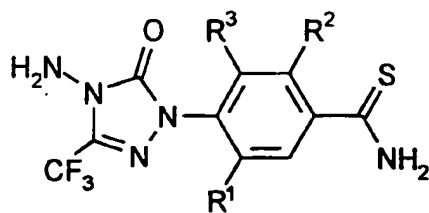
10 Q² für Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppierung aus der Reihe -CO-, -CS-, -CH₂-, -CHF-, -CF₂-, -CHCl-, -CHBr-, -CHOCHF₂-, -CHOCHF₃-, -CHOCH₂CF₃- steht,

- R⁶ für Wasserstoff, Amino, Nitro, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Cyclopropyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlordifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl steht, und
- R⁷ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy steht,
- 10 oder wobei gegebenenfalls zwei benachbarte Gruppen - R⁶ und R⁶ oder R⁷ und R⁷ oder R⁶ und R⁷ - zusammen für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiertes und gegebenenfalls durch Sauerstoff, Schwefel oder eine Gruppierung aus der Reihe -SO-, SO₂-, -N(CH₃)- oder N(C₂H₅)- am Anfang (bzw. am Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette unter-
- 15 brochenes Alkandiyl oder Alkendiyl mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen stehen.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen angegebenen Restdefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zu Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw. Zwischenprodukte. Diese Restdefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen Be-

20 reichen bevorzugter Verbindungen, beliebig kombiniert werden.

Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe 1

(IA-1)

R^1 , R^2 und R^3 haben dabei die in der nachstehenden Auflistung angegebenen Bedeutungen:

Synthese- Bsp.-Nr.	R^1	R^2	R^3
1	H	F	H
2	H	Cl	H
3	H	Cl	Cl
4	Cl	F	H
5	F	F	H
6	F	F	Cl
7	F	CH ₃	H
8	F	C ₂ H ₅	H
9	F	-CH ₂ Cl	H
10	F	F	F
11	F	-NHC ₂ H ₅	H
12	F	-CH ₂ CN	H
13	F	-N(CH ₃)SO ₂ C ₂ H ₅	H
14	Cl	-N(CH ₃)SO ₂ C ₂ H ₅	H

- 15 -

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
15	Cl	-N(CH ₃)SO ₂ C ₂ H ₅	Cl
16	F	-NH-COCF ₃	H
17	F	-OH	H
18	Cl	-OH	H
19	F	-CH(CH ₃) ₂	H
20	F	-NH-SO ₂ -CH ₃	H
21	F	-SO ₂ -CH ₃	H
22	F	-SO ₂ -O-CH ₃	H
23	F	-SO ₂ -NH-CH ₃	H
24	F	-COOCH ₃	H
25	F	-CO-NH-CH ₃	H
26	Cl	-COOCH ₃	Cl
27	Cl	-COOC ₂ H ₅	H
28	F	-O-C ₂ H ₅	H
29	F	-N(C ₂ H ₅)SO ₂ C ₂ H ₅	H
30	F	-N(SO ₂ CH ₃) ₂	H
31	F	-CO-N(CH ₃) ₂	H
32	F	-S-CH ₂ -C≡CH	H
33	Cl	-S-CH ₂ -C≡CH	F

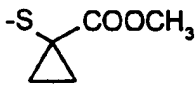
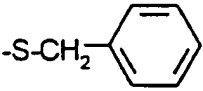
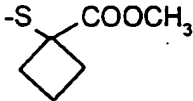
- 16 -

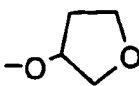
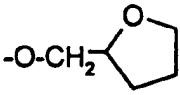
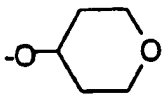
Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
34	F	-S-CH ₂ -C≡CH	Cl
35	F	-O-CH(CH ₃)-C≡CH	H
36	F	-S-CH ₂ -COOCH ₃	H
37	F	-O-CH ₂ CH ₂ -OCH ₃	H
38	F	-O(CH ₂ CH ₂ O) ₂ CH ₃	H
39	F	-O-CH ₂ -CH=CH ₂	H
40	F	-O-CH ₂ -C≡CH	H
41	F	-SH	H
42	F	-S-CH ₃	H
43	F	-S-C ₂ H ₅	H
44	F	-S-CH(CH ₃) ₂	H
45	F	-O-CH ₂ -CF ₃	H
46	F	-O-CH(CH ₂ F) ₂	H
47	F	$\begin{array}{c} \text{-OCHCOOC}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H
48	F	$\begin{array}{c} \text{-OCHCOOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H

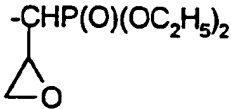
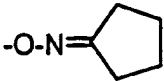
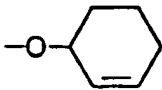
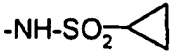
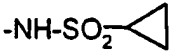
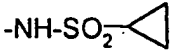
- 17 -

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
49	F	-NH-SO ₂ C ₂ H ₅	H
50	Cl	-NH-SO ₂ C ₂ H ₅	H
51	F	-NH-SO ₂ C ₂ H ₅	Cl
52	F	-NH-SO ₂ CH(CH ₃) ₂	H
53	F	-NH-SO ₂ C ₄ H ₉	H
54	F	-N=CH-OC ₂ H ₅	H
55	F	-N=C(CH ₃)OC ₂ H ₅	H
56	F	-N=C(OCH ₃) ₂	H
57	F	-N=CH-N(CH ₃) ₂	H
58	F	-SCN	H
59	F	-SO ₂ Cl	H
60	F	-O-CS-N(CH ₃) ₂	H
61	F	-S-CO-N(CH ₃) ₂	H
62	F	-NH-P(O)(CH ₃)OC ₂ H ₅	H
63	F	-NH-P(O)(OC ₂ H ₅) ₂	H
64	F	-NH-COC ₂ H ₅	H
65	F	-N(CH ₃)COCF ₃	H
66	F	-NH-COCH(CH ₃) ₂	H
67	F	-NH-CO-CO-C(CH ₃) ₃	H

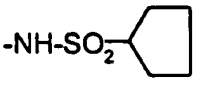
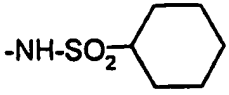
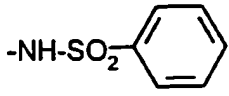
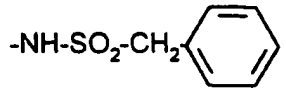
- 18 -

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
68	F	-NH-CO-NH ₂	H
69	F	-NH-CO-NHCH ₃	H
70	F	-NH-CO-N(CH ₃) ₂	H
71	F	-N(COCH ₃) ₂	H
72	F	-NH-COCH(CH ₃)Cl	H
73	F	-S-CH ₂ -CH=CH ₂	H
74	Cl	-S-CH ₂ -CH=CH ₂	H
75	F	-S-CH(CH ₃)C≡CH	H
76	F	-S-CH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	H
77	F	-S(O)-CH ₃	H
78	F		H
79	F		H
80	F		H

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
81	F		H
82	F		H
83	F		H
84	F	-O-CH ₂ -CN	H
85	F	-O-SO ₂ CH ₃	H
86	F	-OCH ₂ -CH(Cl)=CH ₂	H
87	F	-O-CH ₂ -COOCH ₃	H
88	F	-O-CHF ₂	H
89	F	-OCOOCH ₂ CH ₂ Cl	H
90	F	-OCH ₂ P(O)(OC ₂ H ₅) ₂	H
91	Cl	-O-CH(CH ₃)P(O)(OC ₂ H ₅) ₂	H

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
92	F		H
93	F		H
94	F	-O-N(C ₂ H ₅) ₂	H
95	F		H
96	F		H
97	F		Cl
98	Cl		H

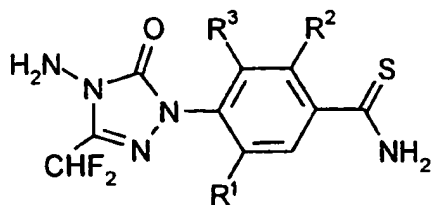
- 21 -

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
99	F		F
100	F		H
101	F		H
102	F		H
103	F	$\text{-NCH(CH}_3)_2\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	H
104	F	$\text{-N(CH}_3\text{)SO}_2\text{CH(CH}_3)_2$	H
105	H	$\text{-N(CH}_3\text{)SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	Cl
106	Cl	$\text{-N(CH}_3\text{)SO}_2\text{C}_4\text{H}_9$	H
107	F	$\text{-N(CH}_3\text{)SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	H
108	F	$\text{-N(CH}_3\text{)SO}_2\text{CH}_3$	H
109	F	$\text{-N(SO}_2\text{C}_2\text{H}_5)_2$	H

- 22 -

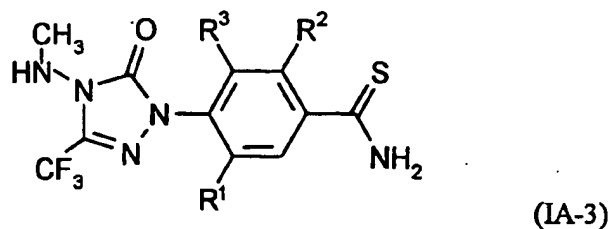
Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
110	F	$-\text{N}(\text{SO}_2\text{CH}_3)\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	H
111	F	$\begin{array}{c} \text{-N-SO}_2\text{C}_2\text{H}_5 \\ \\ \triangle \end{array}$	H
112	F	$-\text{N}(\text{CH}_3)_2$	H
113	F	$-\text{NH}_2$	H
114	Cl	$-\text{NH}_2$	H
115	Cl	$-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
116	F	$-\text{O}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	H
117	F	$\begin{array}{c} \text{-O-} \\ \\ \triangle \end{array}$	H
118	Cl	$\begin{array}{c} \text{-O-} \\ \\ \triangle \end{array}$	H
119	F	$-\text{O}-\text{CH}_2-\text{COOC}_2\text{H}_5$	H
120	F	$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{COOCH}_3$	H
121	F	$-\text{S}-\text{CH}_2-\text{COOC}_2\text{H}_5$	H

Bsp.-Nr.	R ¹	R ²	R ³
122	Cl	-S-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	H
123	F	-CH ₂ -CH(Cl)COOCH ₃	H
124	F	-CH ₂ -CH(Cl)COOC ₂ H ₅	H
125	F	-CH ₂ -CH(Cl)CONHC ₂ H ₅	H
126	Cl	-CH ₂ -CH(Cl)CONHC ₂ H ₅	H
127	Cl	$\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{CHCONHCH(CH}_3)_2 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	H
128	F	$\begin{array}{c} \text{-CH}_2\text{CHCONHCH(CH}_3)_2 \\ \\ \text{Cl} \end{array}$	H
129	F	-COOC ₃ H ₇ -i	H

Gruppe 2

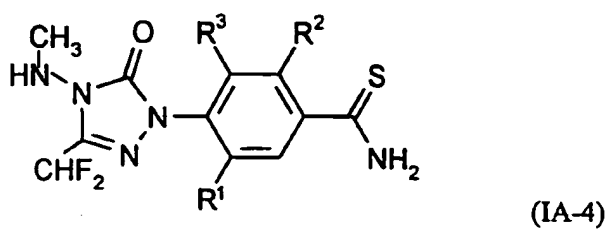
(IA-2)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen
 5 Bedeutungen.

Gruppe 3

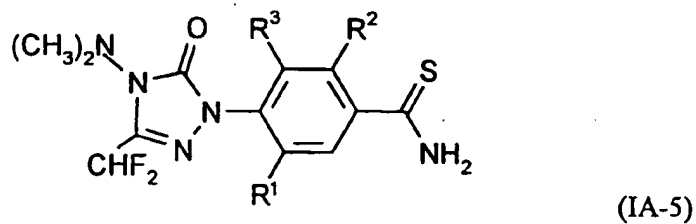
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

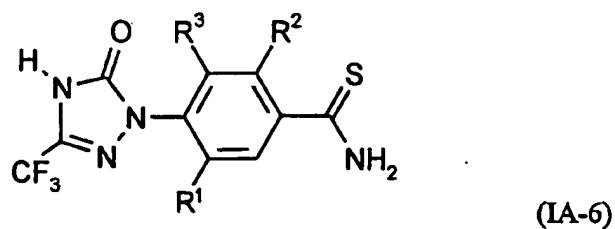
Gruppe 4

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

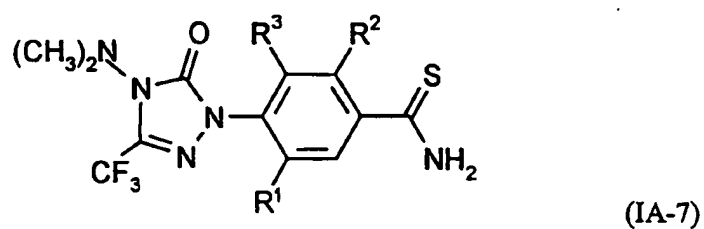
Gruppe 5

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 6

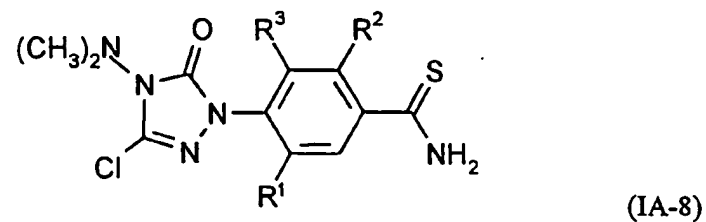
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

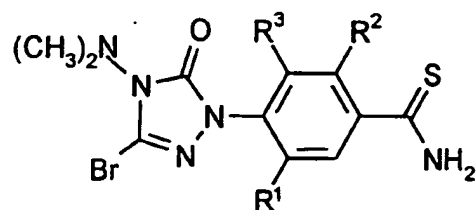
Gruppe 7

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 8

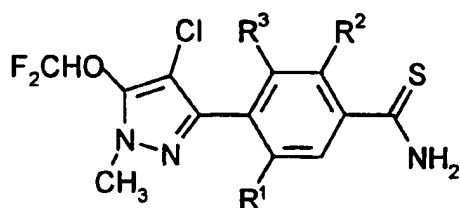
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 9

(IA-9)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

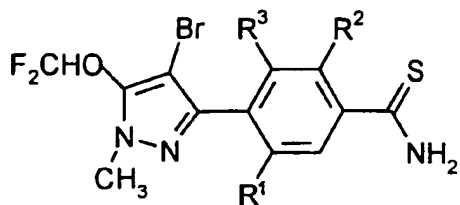
5

Gruppe 10

(IA-10)

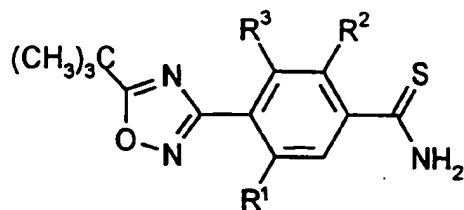
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 11

(IA-11)

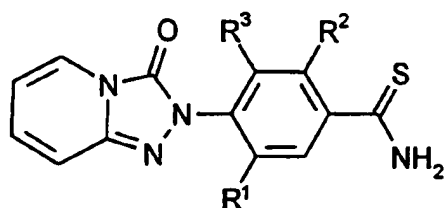
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 12

(IA-12)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

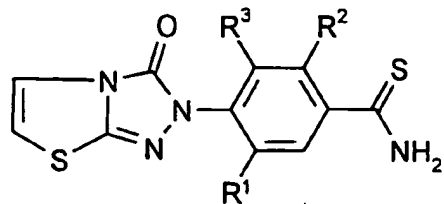
5

Gruppe 13

(IA-13)

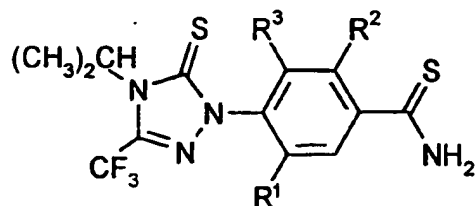
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 14

(IA-14)

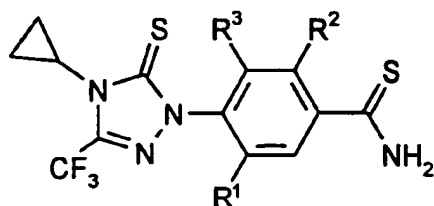
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 15

(IA-15)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

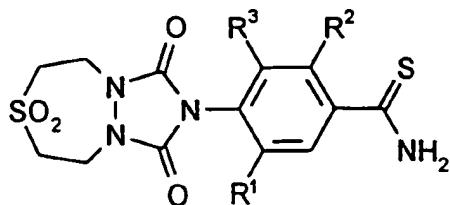
5

Gruppe 16

(IA-16)

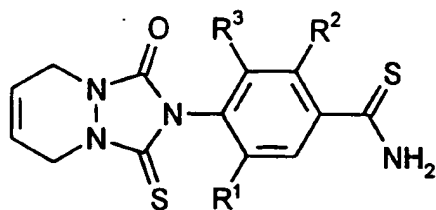
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 17

(IA-17)

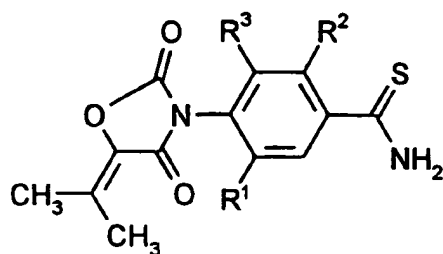
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 18

(IA-18)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

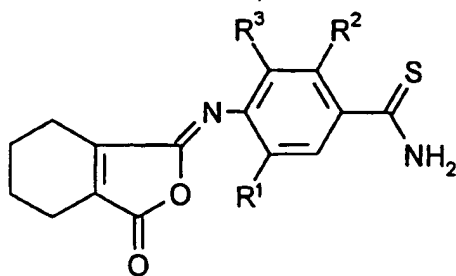
5

Gruppe 19

(IA-19)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

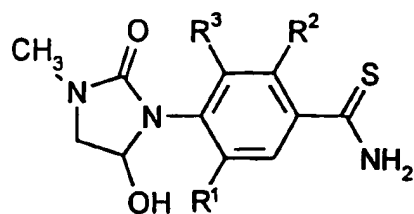
Gruppe 20

(IA-20)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 21

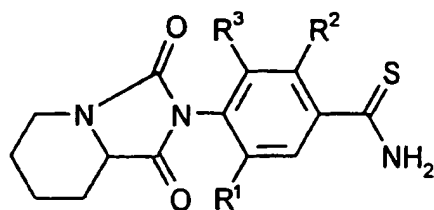
5



(IA-21)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

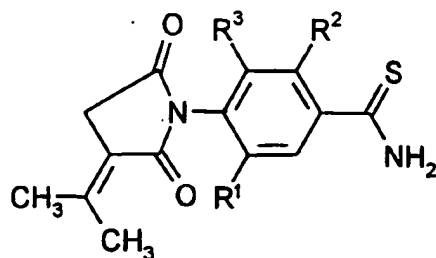
10 Gruppe 22



(IA-22)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

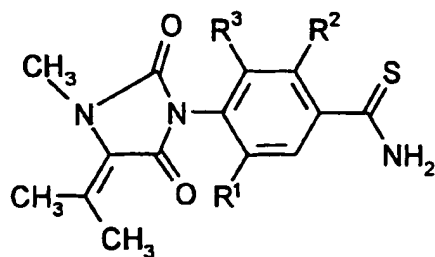
15

Gruppe 23

(IA-23)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

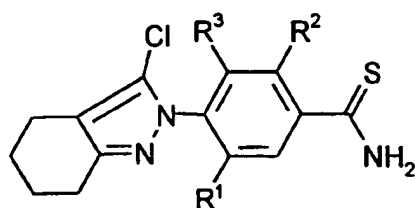
5

Gruppe 24

(IA-24)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

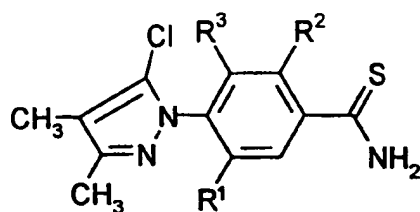
Gruppe 25

(IA-25)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 26

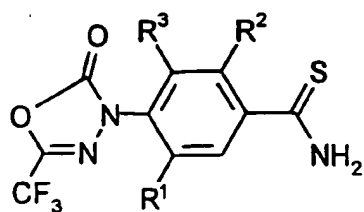
5



(IA-26)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

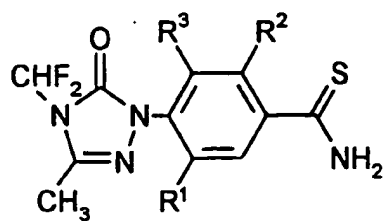
10 Gruppe 27



(IA-27)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

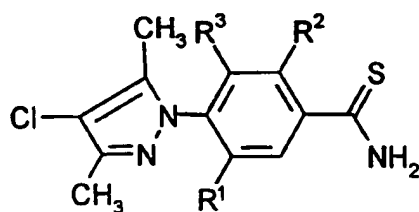
15

Gruppe 28

(IA-28)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

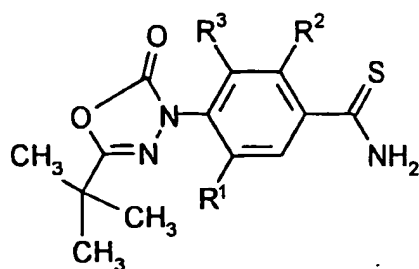
5

Gruppe 29

(IA-29)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

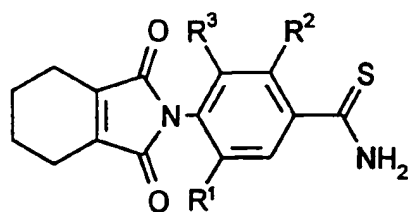
Gruppe 30

(IA-30)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 31

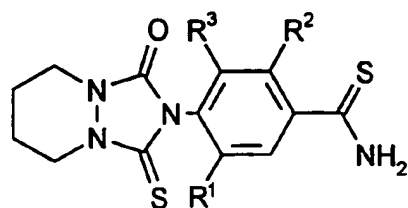
5



(IA-31)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

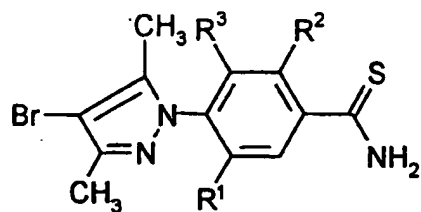
10 Gruppe 32



(IA-32)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

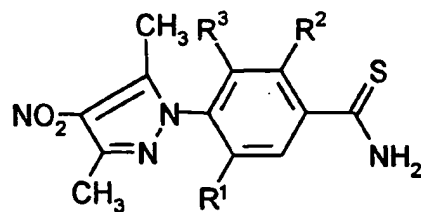
15

Gruppe 33

(IA-33)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

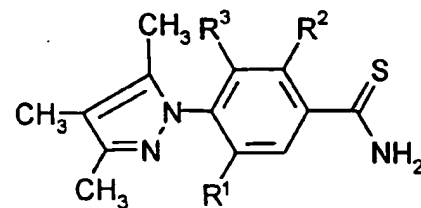
5

Gruppe 34

(IA-34)

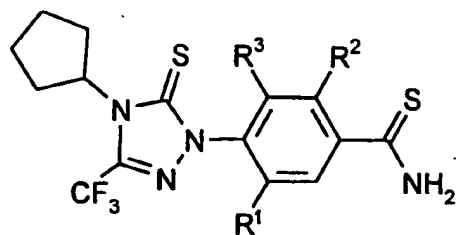
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 35

(IA-35)

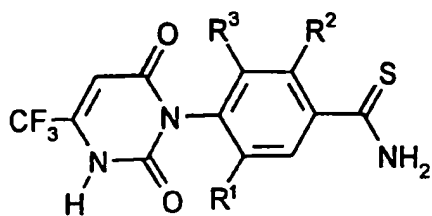
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 36

(IA-36)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

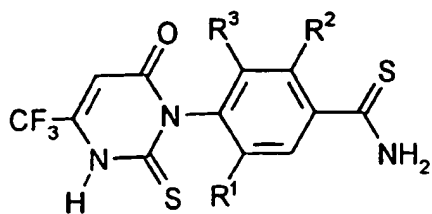
5

Gruppe 37

(IA-37)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 38

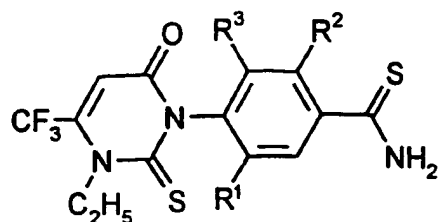
(IA-38)

- 37 -

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 39

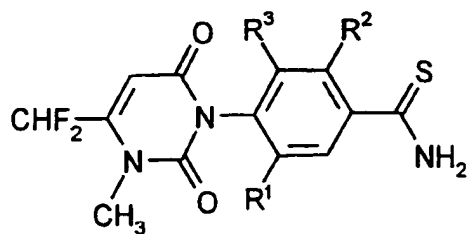
5



(IA-39)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

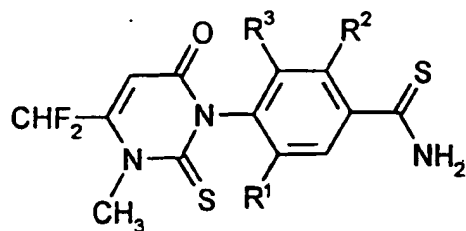
10 Gruppe 40



(IA-40)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

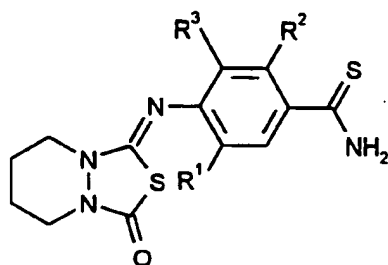
15

Gruppe 41

(IA-41)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

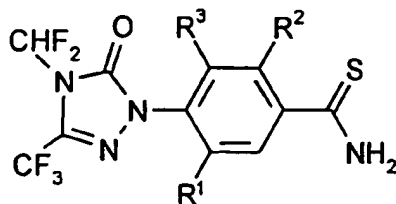
5

Gruppe 42

(IA-42)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

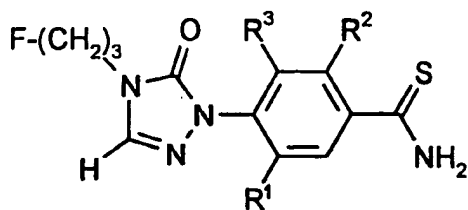
Gruppe 43

(IA-43)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 44

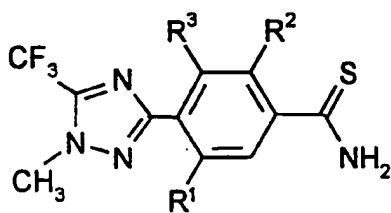
5



(IA-44)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

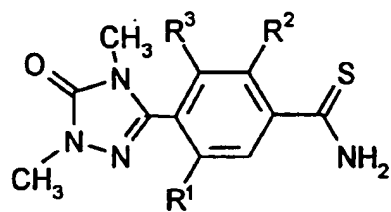
10 Gruppe 45



(IA-45)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

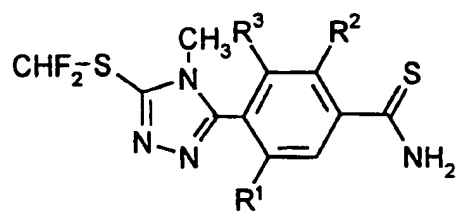
15

Gruppe 46

(IA-46)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

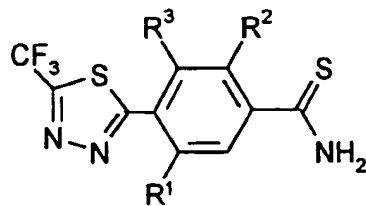
5

Gruppe 47

(IA-47)

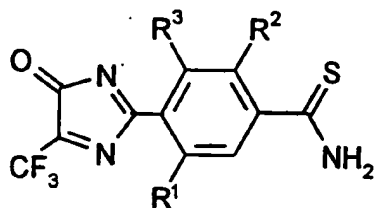
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 48

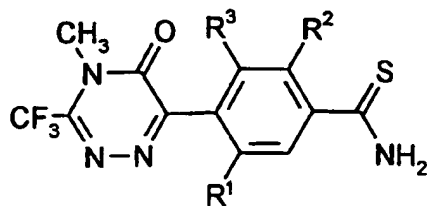
(IA-48)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 49

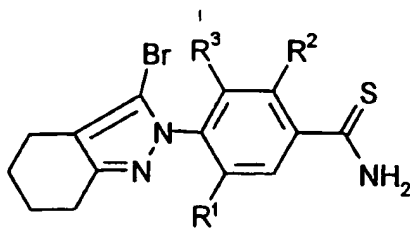
(IA-49)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen
5 Bedeutungen.

Gruppe 50

(IA-50)

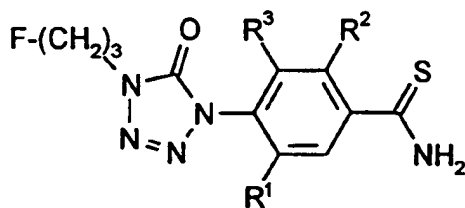
10 R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen
Bedeutungen.

Gruppe 51

(IA-51)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 52

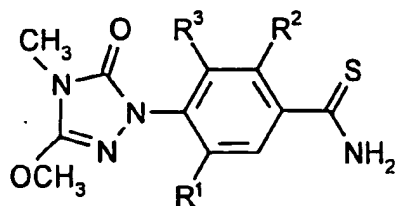


5

(IA-52)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

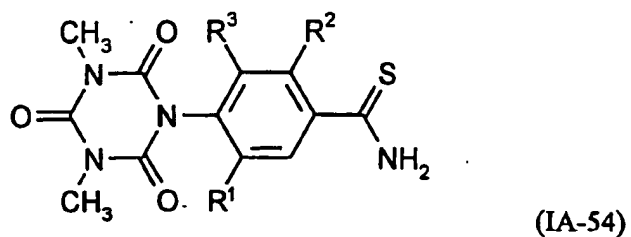
10 Gruppe 53



(IA-53)

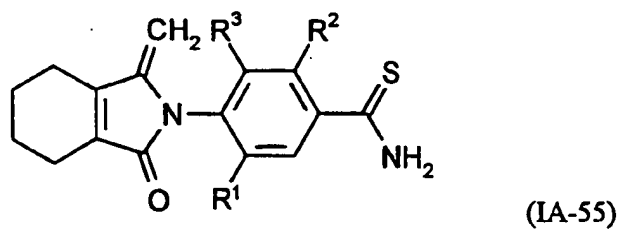
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

15

Gruppe 54

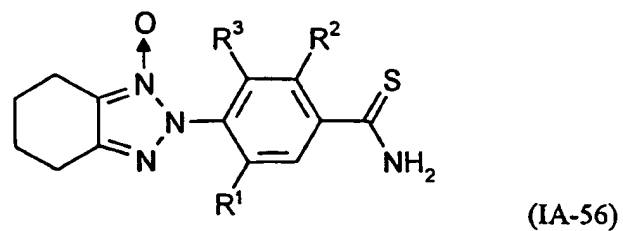
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

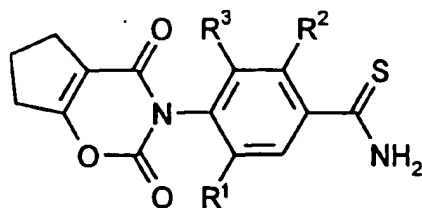
Gruppe 55

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 56

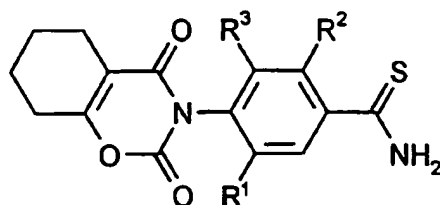
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 57

(IA-57)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

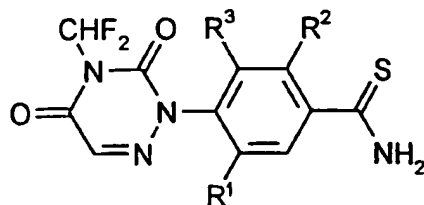
5

Gruppe 58

(IA-58)

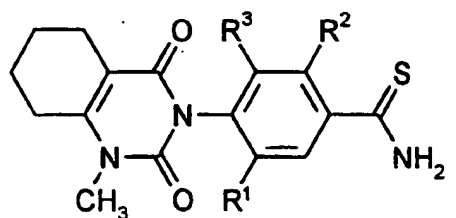
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 59

(IA-59)

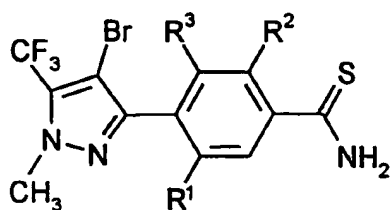
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 60

(IA-60)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

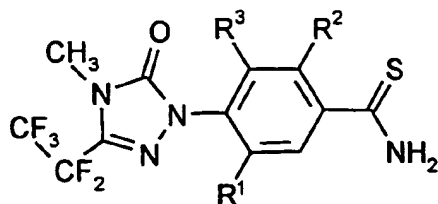
5

Gruppe 61

(IA-61)

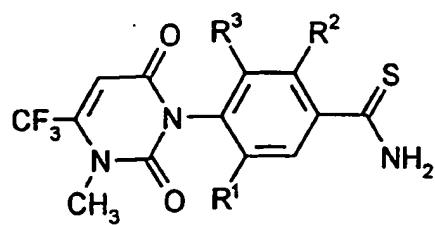
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 62

(IA-62)

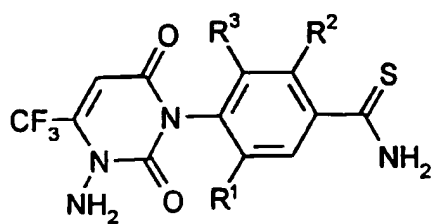
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 63

(IA-63)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

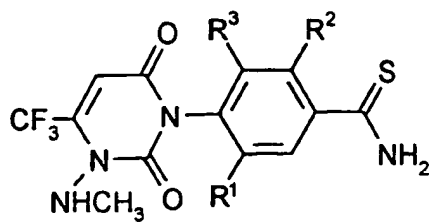
5

Gruppe 64

(IA-64)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

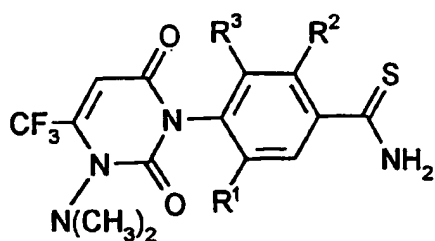
Gruppe 65

(IA-65)

- 47 -

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 66

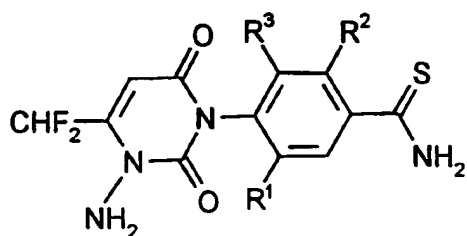


5

(IA-66)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

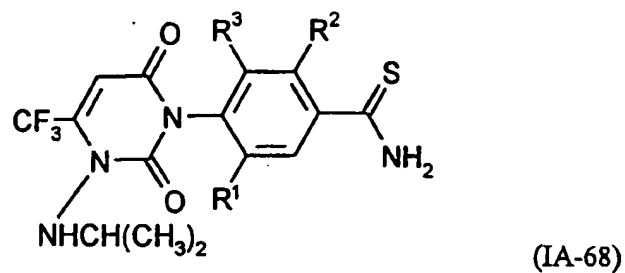
10 Gruppe 67



(IA-67)

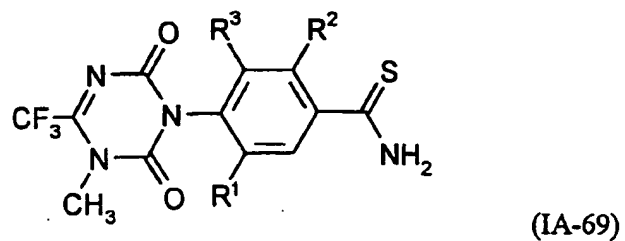
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

15

Gruppe 68

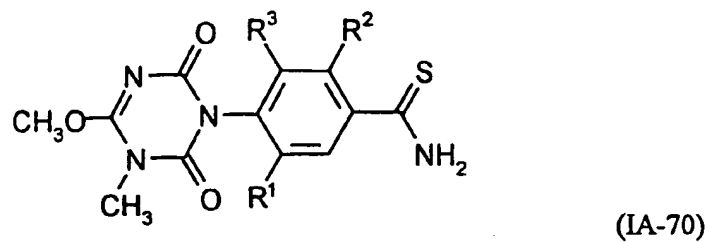
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

5

Gruppe 69

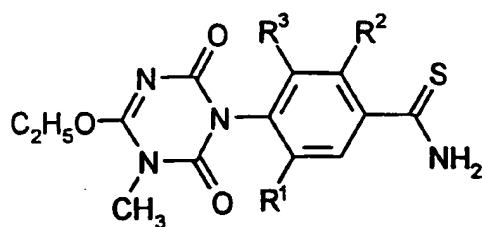
R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 70

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 71

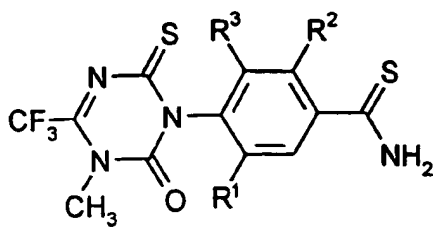


5

(IA-71)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

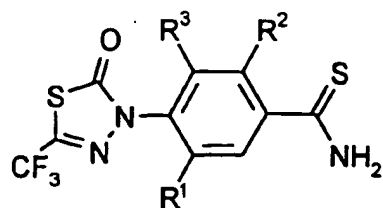
10 Gruppe 72



(IA-72)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

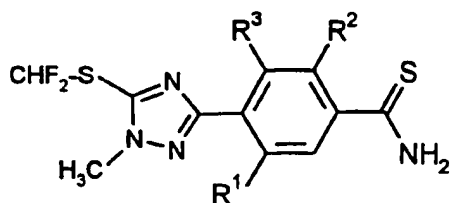
15

Gruppe 73

(IA-73)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

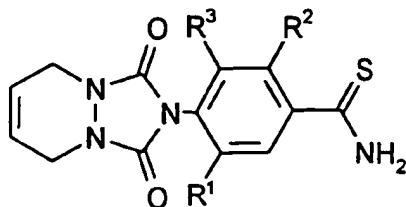
5

Gruppe 74

(IA-74)

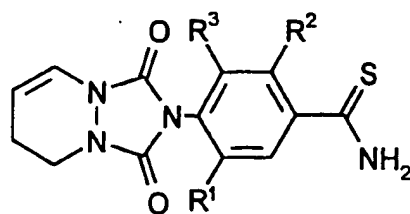
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10

Gruppe 75

(IA-75)

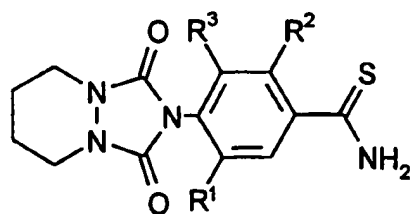
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 76

(IA-76)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

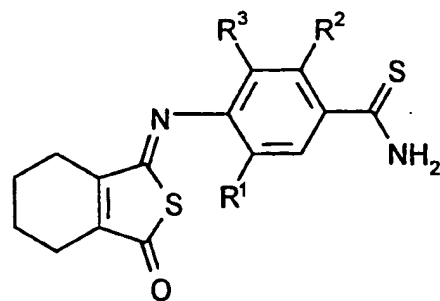
5

Gruppe 77

(IA-77)

R¹, R² und R³ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

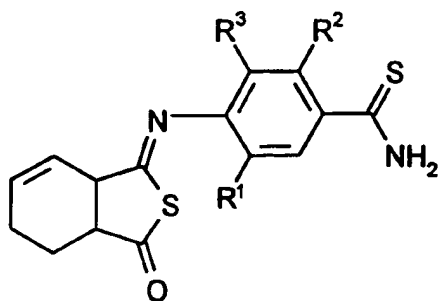
10

Gruppe 78

(IA-78)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 79

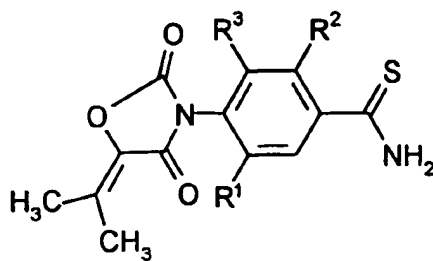


5

(IA-79)

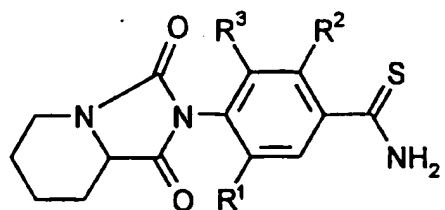
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10 Tabelle 80



(IA-80)

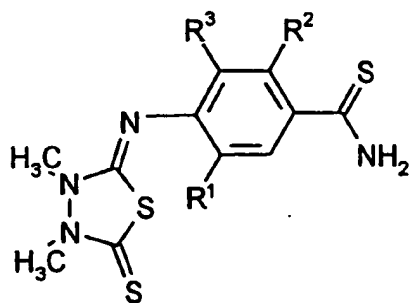
R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 81

(IA-81)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

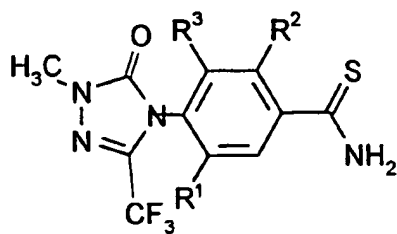
5

Gruppe 82

(IA-82)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

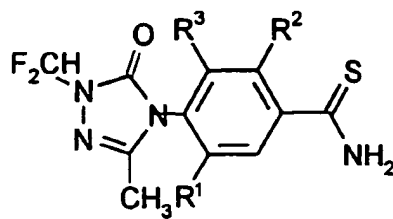
10

Gruppe 83

(IA-83)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

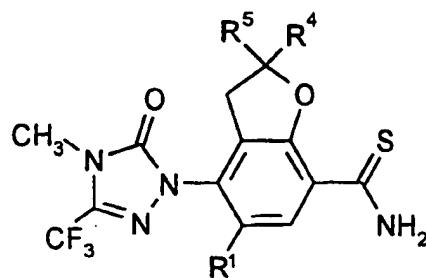
5 Gruppe 84



(IA-84)

R^1 , R^2 und R^3 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 angegebenen Bedeutungen.

10 Gruppe 85



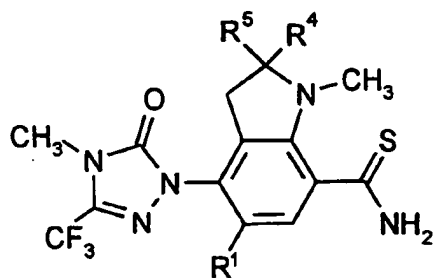
(IB-1)

R^1 , R^4 und R^5 haben dabei die in der nachstehenden Auflistung angegebenen Bedeutungen:

Bsp.-Nr.	R ¹	R ⁴	R ⁵
1	F	CH ₃	CH ₃
2	Cl	CH ₃	CH ₃
3	H	CH ₃	CH ₃
5 4	F	Cl	CH ₃
5	F	Cl	Cl
6	F	C ₂ H ₅	CH ₃

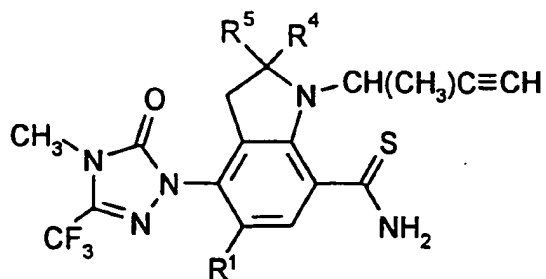
Gruppe 86

10



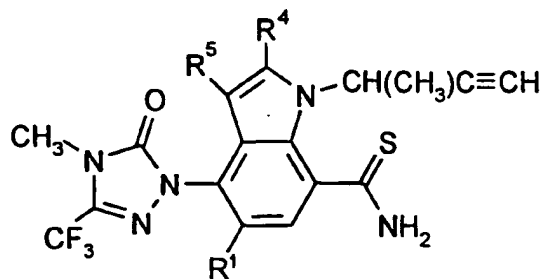
(IB-2)

R¹, R⁴ und R⁵ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 85 angegebenen Bedeutungen.

Gruppe 87

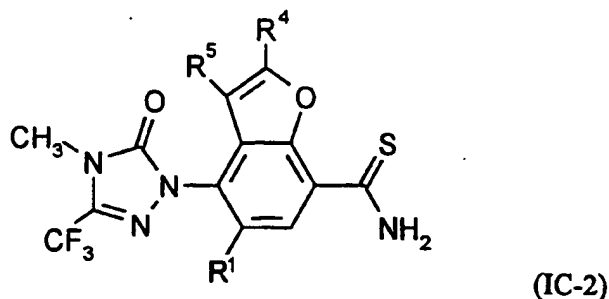
(IB-3)

R^1 , R^4 und R^5 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 85 angegebenen
5 Bedeutungen.

Gruppe 88

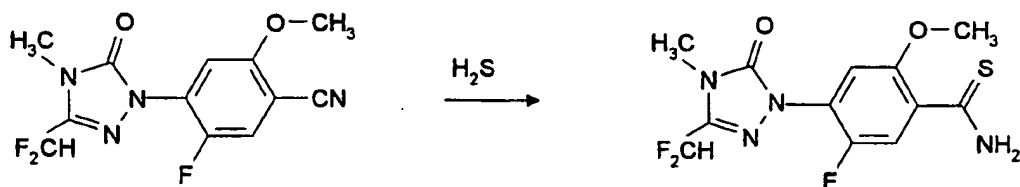
(IC-1)

10 R^1 , R^4 und R^5 haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 85 angegebenen
Bedeutungen.

Gruppe 89

R¹, R⁴ und R⁵ haben hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 85 angegebenen
5 Bedeutungen.

Verwendet man beispielsweise 2-(2-Fluor-4-cyano-5-methoxy-phenyl)-4-methyl-5-
difluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on und Schwefelwasserstoff als Aus-
gangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf des erfindungsgemäßen Verfahrens durch
10 das folgende Formelschema skizziert werden:



Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allge-
meinen Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden substituierten aromatischen
15 Nitrile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben R¹,
R², R³ und Z vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits
oben im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (I) als
bevorzugt bzw. als insbesondere bevorzugt für R¹, R², R³ und Z angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP-A 370332; DE-A 4238125; DE-A 4303376; US-P 5084084; Herstellungsbeispiele).

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens
5 kommen die üblichen organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören insbesondere aliphatische, alicyclische oder aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Petrolether, Hexan, Cyclohexan, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Dioxan, Tetrahydrofuran
10 oder Ethylenglykoldimethyl- oder -diethylether; Ketone, wie Aceton, Butanon oder Methyl-isobutyl-keton; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid, Azine, wie Pyridin, Alko-
15 hole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, Ethylenglykolmonomethylether, Ethylenglykolmonoethylether, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen
20 oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören beispielsweise Erdalkali- oder Alkali-metallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogen-carbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natriummethylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natrium-
25 carbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat sowie basische organische Stickstoffverbindungen, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

30 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man

bei Temperaturen zwischen 0°C und 100°C, vorzugsweise bei Temperaturen zwischen 10°C und 80°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - zu arbeiten.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe der Formel (II) im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels vorgelegt und der Schwefelwasserstoff oder das Thioacetamid wird langsam eindosiert. Vorzugsweise werden der Schwefelwasserstoff oder das Thioacetamid in einem größeren Überschuß eingesetzt. Das Reaktionsgemisch wird mehrere Stunden bei der jeweils erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung erfolgt bei dem erfindungsgemäßen Verfahren jeweils nach üblichen Methoden (vgl. die Herstellungsbeispiele).

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliant, Desiccant, Krautabtötmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewandten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen: Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, 5 Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen. 10 zen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, 15 Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen und dikotylen Kulturen sowohl im Vorauf- als auch im Nachauf-Verfahren. 20

In gewissem Umfang zeigen die Verbindungen der Formel (I) auch fungizide Wirkung, beispielsweise gegen Pyricularia oryzae an Reis.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte 25 Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen

Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

- Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel
- 5 kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie
- 10 Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

- z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Ge-
- 15 steinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emul-
- 20 gierungs- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- 25 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

- 5 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

- 10 Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide infrage, beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4 D, 2,4 DB, 2,4 DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop(-methyl), Fenoxaprop(-ethyl), Fluazifop(-butyl), Haloxypop(-methyl) und
- 15 Quizalofop(-ethyl); Azinone, wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propham; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenyl-ether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Chlormethoxynil (X-52), Chlornitrofen,
- 20 Fluoroglycofen, Fomesafen, Halosafen, Lactofen, Nitrofen und Oxyfluorfen; Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Cumyluron (JC-940), Diuron, Dymron (Daimuron), Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B. Alloxymid, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin;
- 25 Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. AC-014 (AC-322140), Amidosulfuron, Bensulfuron(-methyl), Chlorimuron(-ethyl), Chlorsulfuron, Cinosulfuron, DPX-47, HOE-404, Imazosulfuron, Metsulfuron(-methyl), Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron(-ethyl), Thifensulfuron(-methyl), Triasulfuron und Tribenuron(-methyl);
- 30 Thiolcarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate, Diallylate, Dimepiperate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb (Benthiocarb) und Triallylate; Triazine,

wie z.B. Atrazin, Cyanazin, Dimethametryn, Prometryne, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bensulide, Bentazone, Benzofenap, Bromobutide, Butamifos, Cafenstrole (CH-900), Cinmethylin,
5 Clomazone, Clomeprop, Clopyralid, DEH-112, Difenzoquat, Dimethenamid, Dithiopyr, Ethofumesate, Flumetsulam, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Amiprofos(-methyl), Anilofos, Etobenzanid (HW-52), Isoxaben, KPP-314, KUH-833, KUH-911, KUH-920, MK-243, Naproanilide, NSK-850, Oxadiazon, Piperophos, Propanil, Pyrazolate, Pyrazoxyfen, Pyributicarb, Pyridate, Quinchlorac,
10 Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

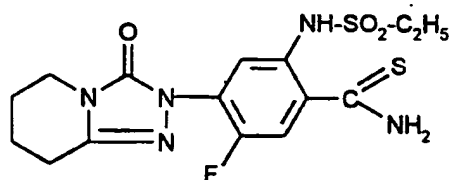
Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus
15 durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor als auch nach dem Auflaufen
20 der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

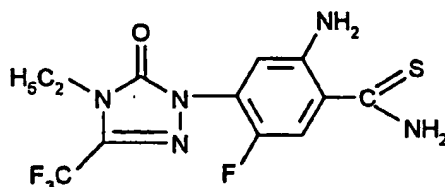
Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 10 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Boden-
25 fläche, vorzugsweise zwischen 50 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

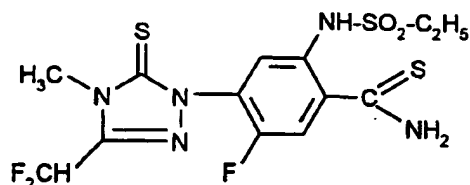
Herstellungsbeispiele:Beispiel 1

- 5 In eine Mischung aus 5,5 g (15 mMol) 2-(4-Cyano-2-fluor-5-ethylsulfonylamino-phenyl)-5,6,7,8-tetrahydro-1,2,4-triazolo[4,3-a]pyridin-3(2H)-on, 5 ml Triethylamin und 50 ml Pyridin wird bei 50°C bis 60°C Schwefelwasserstoff zur Sättigung eingeleitet und die Mischung wird noch 30 Minuten bei 60°C gerührt. Dann wird im Vakuum eingeeengt, der Rückstand mit 2N-Salzsäure verrührt und abfiltriert. Das Festprodukt
- 10 wird aus Isopropanol umkristallisiert.

Man erhält 4,8 g (80% der Theorie) 2-(2-Fluor-5-ethylsulfonylamino-4-thiocarbamoyl-phenyl)-5,6,7,8-tetrahydro-1,2,4-triazolo[4,3-a]pyridin-3(2H)-on vom Schmelzpunkt 220°C.

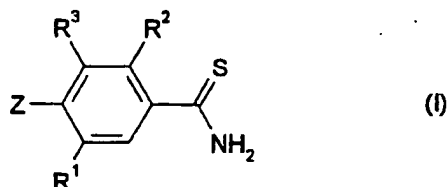
Beispiel 2

- 6,3 g (0,02 Mol) 2-(2-Fluor-4-cyano-5-amino-phenyl)-4-ethyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on werden in 100 ml Aceton mit 4,04 g (0,04 Mol) Triethylamin versetzt. Bei 23°C wird nun zügig Schwefelwasserstoff eingeleitet, wobei die Innentemperatur bis auf 33°C ansteigt. Nach 1 Stunde ist die Reaktion vollständig. Die Lösung wird am Rotationsverdampfer eingeeengt und der Rückstand aus Isopropanol umkristallisiert.
- 10 Man erhält 2,9 g (42% der Theorie) 2-(2-Fluor-4-thiocarbamoyl-5-amino-phenyl)-4-ethyl-5-trifluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-on vom Schmelzpunkt 161°C.

Beispiel 3

- 11 g (0,0276 Mol) 2-(2-Fluor-4-cyano-5-ethylsulfonylamino-phenyl)-4-methyl-5-difluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion werden in 100 ml Pyridin unter Einleiten von Schwefelwasserstoff 4,5 Stunden bei 70°C gerührt. Die Lösung wird am Rotationsverdampfer eingengt, der Rückstand in Wasser verrührt, mit konzentrierter Salzsäure angesäuert, ausgefallenes Produkt abfiltriert, mit Wasser gewaschen und aus Isopropanol umkristallisiert.
- 10 Man erhält 9 g (77% der Theorie) 2-(2-Fluor-4-thiocarbamoyl-5-ethylsulfonylamino-phenyl)-4-methyl-5-difluormethyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-thion vom Schmelzpunkt 183°C.

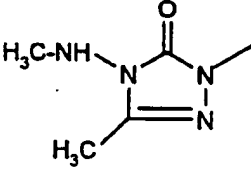
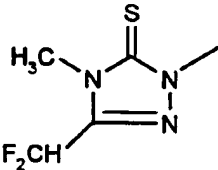
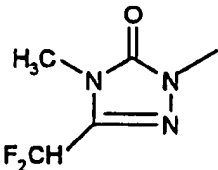
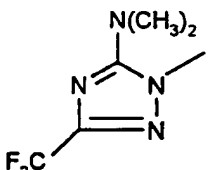
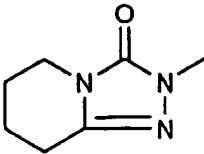
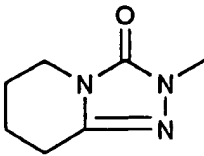
Analog zu den Herstellungsbeispielen 1, 2 und 3 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.



5

Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

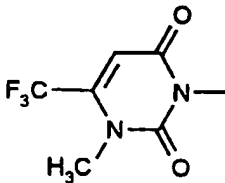
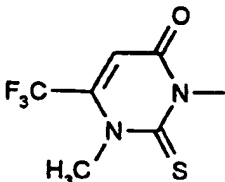
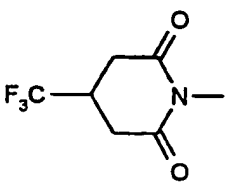
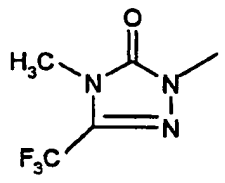
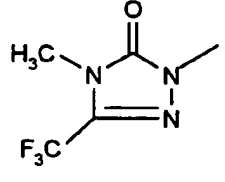
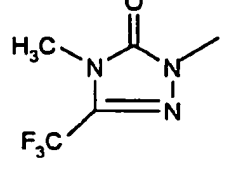
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
4	F	F	H		110
5	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		143
6	F		H		162

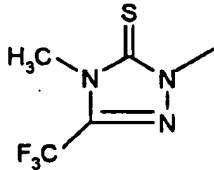
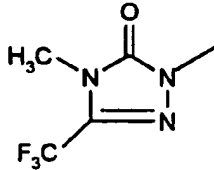
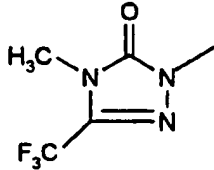
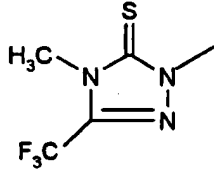
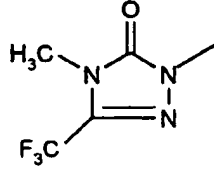
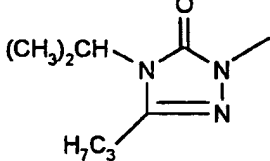
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
7	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		237 (Triethyl- ammonium- salz)
8	F	F	H		220
9	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		218
10	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		185
11	F	F	H		218
12	F	-OC ₂ H ₅	H		202

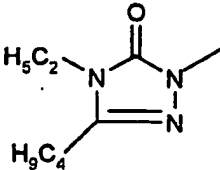
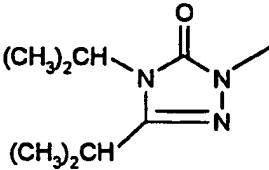
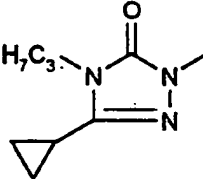
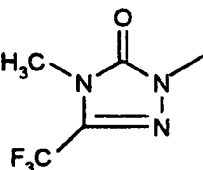
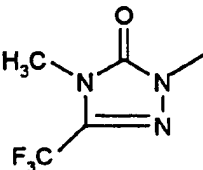
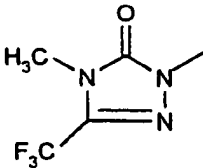
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
13	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		210
14	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		203
15	F	F	H		185
16	F		H		170
17	F	-OCH(CH ₃) ₂	H		206
18	F	OH	H		250

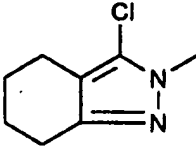
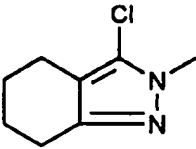
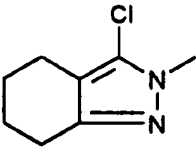
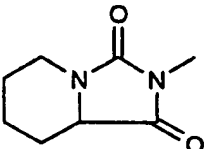
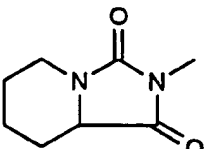
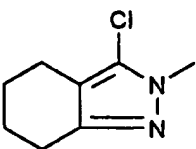
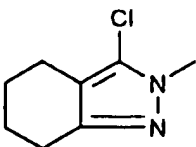
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
19	F	$\begin{array}{c} \text{-N-SO}_2\text{-C}_2\text{H}_5 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H		98
20	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		208
21	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		55
22	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		(amorph)
23	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		183
24	F	$\begin{array}{c} \text{-N-SO}_2\text{-CH}_3 \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H		167

- 71 -

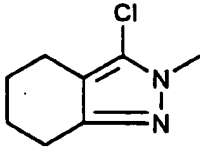
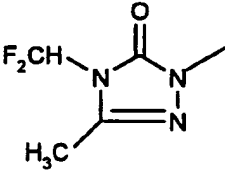
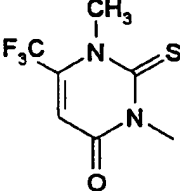
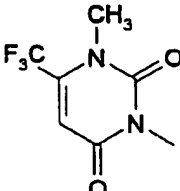
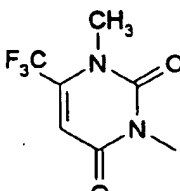
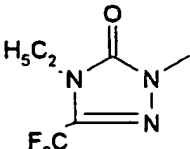
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
25	F	-NH-SO ₂ -CH ₃	H		130
26	F	-NH-SO ₂ -CH ₃	H		243
27	F	F	H		199
28	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		202
29	F	-NH-SO ₂ -CH ₃	H		200
30	F	-NH-SO ₂ -CH(CH ₃) ₂	H		204

Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
31	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		195
32	F	$\begin{array}{c} \text{-O-CH-C}\equiv\text{CH} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H		122
33	F	-O-CH ₂ -C≡CH	H		190
34	F	-NH-SO ₂ -CH ₃	H		178
35	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H ₇	H		203
36	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		199

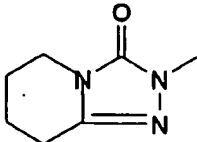
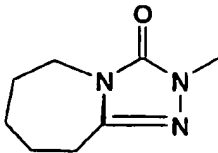
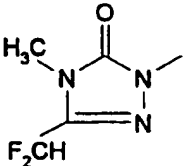
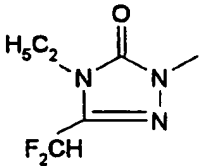
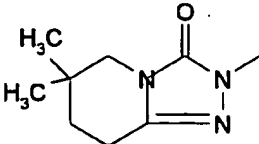
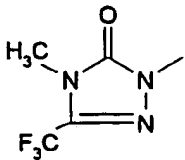
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
37	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		153
38	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		206
39	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		167
40	F	F	H		130
41	F	-OCH ₂ CF ₃	H		173
42	F	-OC ₂ H ₄ OCH ₃	H		148

Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
43	F	-OC ₂ H ₅	H		155
44	F	-OC ₃ H ₇	H		130
45	F	F	H		131
46	F	-OCH(CH ₃) ₂	H		202
47	F	-OC ₂ H ₅	H		185
48	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		111
49	H	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		118

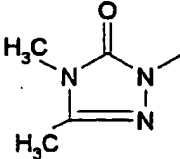
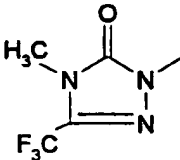
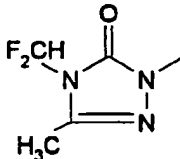
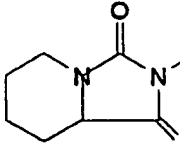
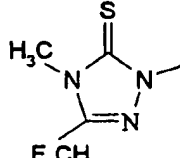
- 75 -

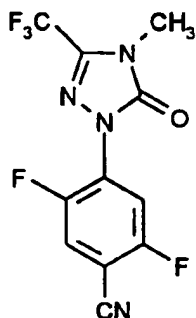
Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
50	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-n}	H		143
51	F	-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃	H		168
52	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-n}	H		(amorph)
53	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-n}	H		232
54	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		226
55	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		187

- 76 -

Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
56	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		236
57	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		252
58	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		109
59	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		207
60	F	-NH-SO ₂ -C ₃ H _{7-i}	H		215
61	F	-N(CH ₃)-SO ₂ C ₂ H ₅	H		102

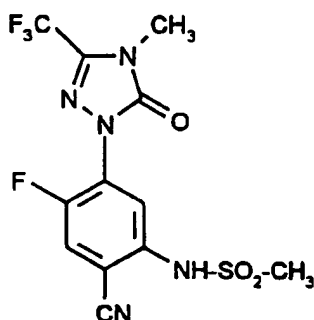
- 77 -

Bsp.- Nr.	R ¹	R ²	R ³	Z	Schmelz- punkt (°C)
62	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		185
63	Cl	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		121
64	F	F	H		157
65	F	-NH-SO ₂ -C ₂ H ₅	H		195
66	F	-OH	H		193 (Z.) DBU-Salz

Herstellung der Ausgangsverbindungen:Beispiel II-1:

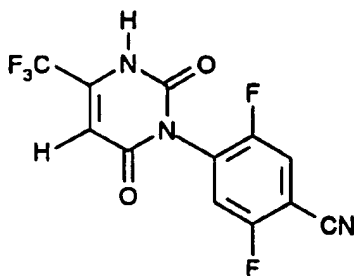
- 5 Zu 6,3 g (0,034 Mol) 4-Methyl-3-trifluormethyl-1,2,4-triazolin-5-on (vgl. z.B. US 3.780.052) und 5,4 g (0,034 Mol) 2,4,5-Trifluorbenzonitril (vgl. z.B. EP 191181) in 150 ml Dimethylsulfoxid gibt man bei Raumtemperatur 5,8 g (0,042 Mol) Kaliumcarbonat und erwärmt anschließend für 14 Stunden auf 100°C. Zur Aufarbeitung wird die abgekühlte Reaktionsmischung in Wasser gegeben, mit verdünnter Salzsäure auf
- 10 pH 2 gebracht und mehrfach mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingengt. Der Rückstand wird über Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan) chromatographiert.

Man erhält 6,2 g (60% der Theorie) 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-4-methyl-3-trifluormethyl-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 74°C.

Beispiel II-2

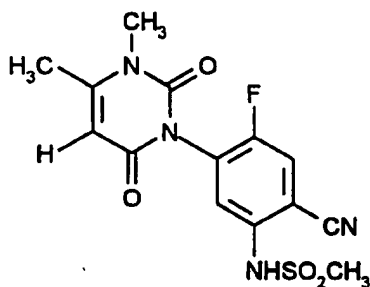
- Zu 1,52 g (0,005 Mol) 1-(4-Cyano-2,5-difluorphenyl)-4-methyl-3-trifluormethyl-
5 1,2,4-triazolin-5-on und 0,48 g (0,005 Mol) Methansulfonsäureamid in 50 ml Dime-
thylsulfoxid gibt man bei Raumtemperatur 0,83 g (0,006 Mol) Kaliumcarbonat und er-
wärmt anschließend für 12 Stunden auf 120°C. Zur Aufarbeitung wird die abgekühlte
Reaktionsmischung in Wasser gegeben, mit verdünnter Salzsäure auf pH 2 gebracht
und mehrfach mit Dichlormethan extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen
10 werden über Natriumsulfat getrocknet und im Vakuum eingeeengt. Der Rückstand
wird über Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Methanol 20:1) chromatographiert.

Man erhält 0,55 g (28% der Theorie) 1-(4-Cyano-2-fluor-5-methylsulfonylaminophe-
nyl)-4-methyl-3-trifluormethyl-1,2,4-triazolin-5-on vom Schmelzpunkt 67°C.

Beispiel II-3

- 1,8 g (10 mMol) 3-Amino-4,4,4-trifluor-crotonsäureethylester werden in 30 ml Dimethylformamid und 2 ml Toluol vorgelegt und bei 0°C bis 5°C mit 0,3 g (10 mMol) Natriumhydrid (80%ig) versetzt. Das Gemisch wird 30 Minuten bei 0°C bis 5°C gerührt. Nach Abkühlen der Mischung auf -70°C werden 0,9 g (5 mMol) 4-Cyano-2,5-difluor-phenylisocyanat - gelöst in 10 ml Toluol - dazugegeben und das Gemisch wird 150 Minuten bei -60°C bis -70°C gerührt. Nach Entfernen des Kühlbades werden 2 ml Essigsäure dazugegeben. Dann wird mit Wasser auf etwa das doppelte Volumen verdünnt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird eingeeengt und der Rückstand mit Diisopropylether zur Kristallisation gebracht.

Man erhält 1,1 g (69% der Theorie) 1-(4-Cyano-2,5-difluor-phenyl)-3,6-dihydro-2,6-dioxo-4-trifluormethyl-1-(2H)-pyrimidin vom Schmelzpunkt 194°C.

Beispiel II-4

- Eine Mischung aus 0,83 g (3 mMol) 1-(4-Cyano-2,5-difluor-phenyl)-3,6-dihydro-2,6-dioxo-3,4-dimethyl-1(2H)-pyrimidin, 0,32 g (3 mMol) Methansulfonamid, 0,6 g Kaliumcarbonat und 10 ml Dimethylsulfoxid wird 10 Stunden auf 120°C erhitzt. Nach Abkühlen wird die Mischung auf Eiswasser gegossen und mit 2N-Salzsäure angesäuert. Dann wird mit Essigsäureethylester extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Vom Filtrat wird das Lösungsmittel im Wasserstrahlvakuum sorgfältig abdestilliert.

Man erhält 0,8 g (76% der Theorie) 1-(4-Cyano-2-fluor-5-methylsulfonylamino-phenyl)-3,6-dihydro-2,6-dioxo-3,4-dimethyl-1(2H)-pyrimidin als kristallinen Rückstand (Schmelzpunkt >250°C).

Anwendungsbeispiele:Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- 10 Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät und nach 24 Stunden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in
- 15 % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle. Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

Tabelle A**Pre-emergence-Test/Gewächshaus**

Wirkstoff (Synthese- beispiel Nummer)	Aufwand -menge (g/ha)	Gerste	Mais	Amaran- thus	Cheno- podium	Matri- caria	Portu- laca	Sola- num
(3)	125	0	0	100	100	100	100	100
(5)	125	0	0	100	100	90	90	100
(6)	125	0	30	100	100	95	100	100
(7)	125	30	0	100	100	95	100	95

Tabelle B**Pre-emergence-Test/Gewächshaus**

Wirkstoff (Synthese- beispiel Nummer)	Aufwand- menge (g/ha)	Weizen	Mais	Abu- thilon	Amaran- thus	Cheno- podium	Matri- caria	Portu- -laca	Sola- num
19	60	10	0	100	95	100	100	100	100
20	60	20	0	100	100	100	100	100	100
21	60	0	0	100	100	100	100	100	100
22	250	0	20	100	100	100	100	95	100
23	60	0	0	95	70	95	100	95	70
24	30	0	20	100	95	100	100	100	100
25	30	0	0	100	100	90	100	100	100
26	60	0	0	100	80	100	100	100	90
4	250	0	10	80	50	70	95	90	70
5	125	0	0	10	100	100	70	90	100
3	60	0	0	100	100	100	100	100	100
6	60	20	30	100	100	100	100	100	95
7	125	50	0	95	100	100	95	100	95
8	60	40	0	100	100	100	95	95	100
9	60	0	0	100	100	100	95	90	100
1	125	0	0	100	100	100	95	100	100
12	60	20	0	70	70	100	95	95	70
13	60	0	0	100	100	100	70	90	100
16	60	10	0	95	20	100	90	80	80
17	30	0	0	100	100	100	100	100	100

Tabelle B (Fortsetzung)

Pre-emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff (Synthese- beispiel Nummer)	Aufwand- menge (g/ha)	Weizen	Mais	Abu- thion	Amaran- thus	Cheno- podium	Matri- caria	Portu- -laca	Sola- num
28	60	0	20	100	100	100	100	100	100
29	60	0	0	100	100	100	100	100	100
30	60	0	0	100	100	100	90	100	100
31	60	0	0	100	100	100	100	100	100
32	30	10	0	-	100	100	100	95	100
33	30	10	10	95	95	100	100	100	100
34	60	0	0	100	100	100	100	100	100
35	60	0	0	100	100	100	90	95	100
40	250	20	0	30	40	100	95	100	80
41	60	20	30	100	100	100	100	100	100
45	125	0	0	95	100	100	100	90	95
46	60	0	70	100	100	100	100	100	100
47	30	0	0	100	95	100	100	100	100
48	60	0	0	100	100	100	100	100	100
51	30	0	20	100	-	100	95	100	100

Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel: 5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

5 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1
Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die ange-
gebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die
gewünschte Konzentration.

10 Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 bis
15 cm haben, so daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit
ausgebracht werden. Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen
bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

Tabelle C**Post-emergence-Test/Gewächshaus**

Wirkstoff (Synthese- -beispiel Nummer)	Aufwand- menge (g/ha)	Weizen	Mais	Abu- thilon	Amaran- thus	Cheno- podium	Sola- num	Vero- nica
19	4	5	20	95	95	95	100	100
20	4	0	15	100	95	95	100	95
21	4	5	60	90	100	70	100	100
22	30	15	0	100	100	40	100	20
23	30	0	50	95	-	90	100	100
24	30	15	70	100	100	100	100	100
25	15	0	50	100	100	100	100	100
26	15	0	30	50	90	50	50	100
5	15	10	20	100	100	100	100	100
3	30	10	30	100	100	100	100	100
6	8	30	50	100	100	100	100	95
7	60	10	50	100	100	95	100	95
8	60	10	30	100	100	100	100	100
9	60	10	30	100	100	100	100	100
1	15	10	50	100	95	95	100	100
12	8	10	30	100	100	95	100	100
13	15	0	30	95	100	80	100	90
16	60	20	60	95	100	100	100	100
17	8	10	10	100	100	95	100	100

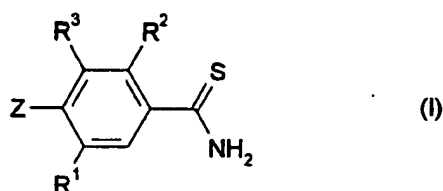
Tabelle C (Fortsetzung)

Post-emergence-Test/Gewächshaus

Wirkstoff (Synthese- beispiel Nummer)	Aufwand- menge (g/ha)	Weizen	Mais	Abu- thilon	Amaran- thus	Cheno- podium	Sola- num	Vero- nica
28	30	0	30	100	100	90	100	100
29	8	5	0	70	100	90	100	95
30	8	0	50	100	100	95	100	70
31	8	0	70	100	100	90	100	100
32	4	15	30	100	100	95	100	100
33	4	20	60	100	100	100	100	100
34	15	0	30	100	100	100	100	100
35	30	0	25	100	100	90	100	95
40	125	10	5	50	70	100	100	90
41	15	20	50	100	80	90	100	95
43	15	0	50	100	95	100	100	100
44	8	0	15	100	100	100	95	100
45	8	10	40	95	95	95	100	-
46	8	15	20	100	100	95	100	100
47	8	10	10	100	100	95	100	100
48	8	5	60	100	100	80	100	100
49	8	0	60	60	100	10	100	100
50	15	5	70	100	95	80	100	95
51	15	15	60	100	100	70	100	100

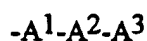
Patentansprüche

1. Substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I)



in welcher

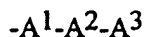
- 5 R^1 für Wasserstoff oder Halogen steht,
 R^2 für die nachstehende Gruppierung steht,



worin

- 10 A^1 für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-,
 -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasser-
 stoff, Hydroxy, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Aryl, Alkylsulfonyl
 oder Arylsulfonyl steht,
- 15 A^1 weiterhin für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Alken-
 diyl, Alkindiyl, Cycloalkandiyl, Cycloalkendiyl oder Arendiyl steht,
- A^2 für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-,
 -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasser-
 stoff, Hydroxy, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Aryl, Alkoxy, Alkylsulfonyl
 oder Arylsulfonyl steht,
- 20 A^2 weiterhin für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Alken-
 diyl, Alkindiyl, Cycloalkandiyl, Cycloalkendiyl oder Arendiyl steht,

- 5 A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Isocyano, Thiocyanato, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Sulfo, Chlorsulfonyl, Halogen oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkoxy-carbonyl, Dialkoxy(thio)phosphoryl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenylamino, Alkylidenamino, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyl, Alkinyloxy, Alkinylamino, Alkinyloxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylidenamino, Cycloalkyloxycarbonyl, Cycloalkylalkoxycarbonyl, Aryl, Aryloxy, Arylalkyl, Arylalkoxy, Aryloxycarbonyl, Arylalkoxycarbonyl, Heterocyclyl, Heterocyclylalkyl, Heterocyclylalkoxy oder Heterocyclylalkoxycarbonyl steht,
- 10 R³ für Wasserstoff, Halogen oder zusammen mit R² für eine Alkandiyl- oder eine Alkendiyl-Gruppierung steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO₂-Gruppierung, eine NH-Gruppierung, eine N-Alkyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält, und
- 15 Z für jeweils gegebenenfalls substituiertes monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino steht.
- 20 2. Substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- R¹ für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Brom steht,
- 25 R² für die nachstehende Gruppierung steht,



in welcher

- A¹ für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,
- 5 A¹ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl, C₂-C₆-Alkindiyl, C₃-C₆-Cycloalkandiyl, C₃-C₆-Cycloalkendiyl oder Phenylen steht,
- 10 A² für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₄-Alkenyl, C₃-C₄-Alkynyl, C₁-C₄-Alkoxy, Phenyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,
- A² weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes C₁-C₆-Alkandiyl, C₂-C₆-Alkendiyl, C₂-C₆-Alkindiyl, C₃-C₆-Cycloalkandiyl, C₃-C₆-Cycloalkendiyl oder Phenylen steht,
- 15 A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Isocyano, Thiocyanato, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Sulfo, Chlorsulfonyl, Halogen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkoxy, Alkylthio, Alkylsulfinyl, Alkylsulfonyl, Alkylamino, Dialkylamino, Alkoxycarbonyl oder Dialkoxy-
- 20 (thio)phosphoryl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiertes Alkenyl, Alkenyloxy, Alkenylamino, Alkylidenamino, Alkenyloxycarbonyl, Alkynyl, Alkynyloxy, Alkynylamino oder Alkynyloxycarbonyl mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den Alkenyl-,
- 25 Alkyliden- oder Alkynylgruppen, für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Carboxy, C₁-C₄-Alkyl und/oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyloxy, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkoxy, Cycloalkylidenamino, Cycloalkyloxycarbonyl oder Cycloalkylalkoxycarbonyl mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoff-
- 30 atomen in den Cycloalkylgruppen und gegebenenfalls 1 bis 4

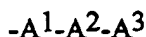
- 5 Kohlenstoffatomen in den Alkylgruppen, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyloxy und/oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Phenyl, Phenyl-
 10 Phenyl-C₁-C₄-alkyl, Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, Phenylloxycarbonyl oder Phenyl-C₁-C₄-alkoxycarbonyl, (jeweils gegebenenfalls ganz oder teilweise hydriertes) Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Furyl, Thienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Pyrazolyl-C₁-C₄-alkyl, Furyl-C₁-C₄-alkyl, Thienyl-C₁-C₄-alkyl, Oxazolyl-C₁-C₄-alkyl, Isoxazol-C₁-C₄-alkyl, Thiazol-C₁-C₄-alkyl, Pyridinyl-C₁-C₄-alkyl, Pyrimidinyl-C₁-C₄-alkyl, Pyrazolylmethoxy, Furylmethoxy, für Perhydropyranylmethoxy oder Pyridylmethoxy steht,
- 15 R³ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder zusammen mit R² für eine Alkandiyl oder Alkendiyl-Gruppierung mit jeweils bis zu 4 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine SO₂-Gruppierung, eine NH-Gruppierung, eine N-C₁-C₄-Alkyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält,
 20 und
- 25 Z für jeweils monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 4 Stickstoffatomen im heterocyclischen Ringsystem steht, welches gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und/oder gegebenenfalls bis zu drei Gruppierungen aus der Reihe -CO-, -CS-, -SO- und/oder SO₂- enthält, und welches gegebenenfalls substituiert ist durch eine oder mehrere Gruppierungen aus der Reihe Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Halogen, C₁-C₆-Alkyl (welches gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert ist), C₂-C₆-Alkenyl oder C₂-C₆-Alkinyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkoxy oder C₁-C₆-Alkoxy-carbonyl (welche
- 30

jeweils gegebenenfalls durch Halogen oder C₁-C₄-Alkoxy substituiert sind), C₂-C₆-Alkenyloxy oder C₂-C₆-Alkinyloxy (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkylthio, C₂-C₆-Alkenylthio oder C₂-C₆-Alkinylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituiert sind), C₁-C₆-Alkylamino oder Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, C₃-C₆-Cycloalkyl oder C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sind), Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl oder Phenylamino (welche jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkyloxy, C₁-C₄-Halogenalkyloxy und/oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiert sind).

3. Substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß

R¹ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,

R² für die nachstehende Gruppierung steht,



in welcher

A¹ für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylsulfonyl oder Ethylsulfonyl steht,

A¹ weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl, Propin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,

A² für eine Einfachbindung, für Sauerstoff, Schwefel, -SO-, -SO₂-, -CO- oder die Gruppierung -N-A⁴- steht, worin A⁴ für Wasserstoff, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy,

n- oder i-Propoxy, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl oder Phenylsulfonyl steht,

5 A² weiterhin für Methylen, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl, Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl, Ethen-1,2-diyl, Propen-1,2-diyl, Propen-1,3-diyl, Ethin-1,2-diyl, Propin-1,2-diyl oder Propin-1,3-diyl steht,

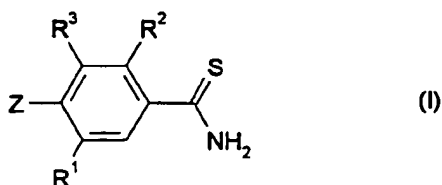
10 A³ für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Cyano, Nitro, Carboxy, Carbamoyl, Sulfo, Fluor, Chlor, Brom, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s- oder t-Butoxy, n-, i-, s- oder t-Pentyloxy, Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder i-Propylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder i-Propylsulfonyl, Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino, Diethylamino, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, Dimethoxyphosphoryl, Diethoxyphosphoryl, Dipropoxyphosphoryl oder Diisopropoxyphosphoryl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiertes Propenyl, Butenyl, Propenyloxy, Butenyloxy, Propenylamino, Butenylamino, Propylidenamino, Butylidenamino, Propenyloxycarbonyl, Butenyloxycarbonyl, Propinyl, Butinyl, Propinyloxy, Butinyloxy, Propinylamino, Butinylamino, Propinyloxycarbonyl oder Butinyloxycarbonyl, für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Cyano, Carboxy, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy, Cyclopentylmethoxy, Cyclohexylmethoxy, Cyclopentylidenamino, Cyclohexylidenamino, Cyclopentyloxycarbonyl, Cyclohexyloxycarbonyl, Cyclopentylmethoxy-

15
20
25
30

- carbonyl oder Cyclohexylmethoxycarbonyl, oder für jeweils gegebenenfalls durch Nitro, Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl und/oder Ethoxycarbonyl substituiertes Phenyl, Phenyl-
 5 oxy, Benzyl, Phenylethyl, Benzyloxy, Phenylloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, (jeweils gegebenenfalls ganz oder teilweise hydriertes) Pyrrolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Triazolyl, Furyl, Thienyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxadiazolyl, Thiadiazolyl,
 10 Pyridinyl, Pyrimidinyl, Triazinyl, Pyrazolylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolmethyl, Thiazolmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyrazolylmethoxy, Furylmethoxy oder Pyridylmethoxy steht,
- 15 R^3 für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder zusammen mit R^2 für eine Alkandiyl oder Alkendiyl-Gruppierung mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen steht, die gegebenenfalls am Anfang (bzw. Ende) oder innerhalb der Kohlenwasserstoffkette ein Sauerstoffatom, ein Schwefelatom, eine NH-Gruppierung, eine N-Methyl-Gruppierung, eine Carbonylgruppe und/oder eine Thiocarbonylgruppe enthält, und
- 20 Z für jeweils monocyclisches oder bicyclisches, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, Heterocyclylamino oder Heterocyclylimino mit jeweils 2 bis 5 Kohlenstoffatomen und 1 bis 3 Stickstoffatomen im heterocyclischen Ringsystem steht, welches gegebenenfalls zusätzlich ein Sauerstoff- oder Schwefelatom und/oder gegebenenfalls bis zu zwei
 25 Gruppierungen aus der Reihe -CO-, -CS-, -SO- und/oder SO₂- enthält, und welches gegebenenfalls substituiert ist durch eine oder mehrere Gruppierungen aus der Reihe Nitro, Hydroxy, Amino, Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom; Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, (welche gegebenenfalls durch Fluor,
 30 Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiert sind); Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i-, s-

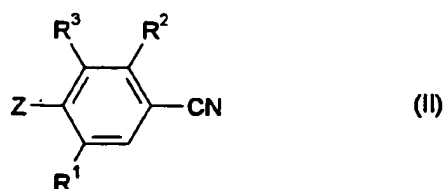
oder t-Butoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl (welche jeweils gegebenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiert sind); Propenyloxy, Butenyloxy, Propinyloxy oder Butinyloxy (welche gegebenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methylthio, Ethylthio, n- oder i-Propylthio, n-, i-, s- oder t-Butylthio, Propenylthio, Butenylthio, Propinylthio oder Butinylthio (welche jeweils gegebenfalls durch Fluor oder Chlor substituiert sind); Methylamino, Ethylamino, n- oder i-Propylamino, n-, i-, s- oder t-Butylamino, Dimethylamino oder Diethylamino; Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl (welche jeweils gegebenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl substituiert sind), Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Phenylsulfinyl, Phenylsulfonyl oder Phenylamino (welche jeweils gegebenfalls durch Nitro, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Methoxycarbonyl oder Ethoxycarbonyl substituiert sind).

4. Verfahren zur Herstellung von substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamiden der allgemeinen Formel (I)



in welcher R^1 , R^2 , R^3 und Z die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte aromatische Nitrile der allgemeinen Formel (II)

- 97 -



in welcher

R¹, R², R³ und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit Schwefelwasserstoff (Hydrosulfid, H₂S) oder mit Thioacetamid gegebenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

5. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
6. Verwendung von substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamiden der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
7. Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte aromatische Thiocarbonsäureamide der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Substanzen vermischt.
8. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem substituierten aromatischen Thiocarbonsäureamid der allgemeinen Formel (I) gemäß der Ansprüche 1 bis 4.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP 95/01507

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 C07D249/10 A01N43/00 C07D471/04 C07D239/54 C07D239/56
C07D207/452 C07D209/48 C07D211/88 C07D231/56 C07D487/04

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 C07D A01N C07C

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO,A,93 24472 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 9 December 1993 see page 72, 1 st compound ---	1-4,7,8
X	WO,A,93 22303 (GLAXO GROUP LIMITED) 11 November 1993 see page 11, formula II, pages 34,35 and 42, intermediate products 10 and 30	1-4,7,8
X	WO,A,93 14077 (GLAXO GROUP LIMITED) 22 July 1993 see page 13, formula II, and intermediate products 6,24,41,47,49,51,54,56,58,61 and 64 -/--	1-4,7,8

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "I" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 July 1995

Date of mailing of the international search report

21. 07. 95

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Allard, M

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 95/01507

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	EP,A,0 537 980 (GLAXO GROUP LIMITED) 21 April 1993 see page 4, formula II, and intermediate products 16,17 and 19 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 542 363 (GLAXO GROUP LIMITED) 19 May 1993 see page 7, formula II, and intermediate products 10,17,25 and 32 ---	1-4,7,8
X	WO,A,90 09381 (ABBOTT LABORATORIES) 23 August 1990 see page 20, compound 21, and example 21 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 384 362 (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 29 August 1990 see example 30c ---	1-4,7,8
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 1, 7 January 1991, Columbus, Ohio, US; abstract no. 6530s, page 646 ; see abstract & JP,A,02 193 994 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.) & CHEM. ABS. 12TH COLL. IND. CHEM. SUBST. page 10864CS see middle column last compound and left column first compound ---	1-4,7,8
X	US,A,5 204 352 (R.J. SUNDBERG ET AL.) 20 April 1993 see columns 11,12, compound BK11743 ---	1-4,7,8
X	JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, vol.25, no.1, January 1988, PROVOH US pages 129 - 137 R.J. SUNDBERG ET AL. 'Preparation of 2-aryl and 2-aryloxymethyl imidazo[1,2-a]pyridines and related compounds' see page 130, compound 3 an ---	1-4,7,8
X	JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol.30, no.6, June 1987, WASHINGTON US pages 1023 - 1029 I. SIRCAR ET AL. 'Cardiotonic agents. 5. 1,2-Dihydro-5[4-(1H-imidazol-1-yl)phenyl]- 6-methyl-2-oxo-3-pyridinecarbonitriles and related compounds. Synthesis and inotropic activity' see page 1025, compound 18 ---	1-4,7,8
	--- -/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter national Application No

PCT/EP 95/01507

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 103, no. 9, 2 September 1985, Columbus, Ohio, US; abstract no. 71307m, page 652 ; see abstract & JP,A,59 225 172 (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) & CHEM. ABS. 11TH COLL. IND. CHEM. SUBST. page 7859CS see middle column, second compound ---	1-4,7,8
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 91, no. 22, 26 November 1979, Columbus, Ohio, US; abstract no. 184919q, page 646-647 ; see abstract & JP,A,79 067 419 (KONISHIROKU PHOTO INDUSTRY CO., LTD.) ---	1-4,7,8
X	US,A,4 515 791 (G.R. ALLEN JR. ET AL.) 7 May 1985 see example 3 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 052 442 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC) 26 May 1982 see example 40 ---	1-4,7,8
X	US,A,4 112 095 (G.R. ALLEN JR. ET AL.) 5 September 1978 see example 14 ---	1-4,7,8
X	DE,A,21 62 439 (BADISCHE ANILIN- UND SODA-FABRIK AG) 20 June 1973 see example 4, initial compound ---	1-4,7,8
X	DE,A,22 04 767 (HENKEL & CIE, GMBH) 9 August 1973 see page 5, formula 15, and pages 20 and 23 ---	1-4,7,8
X	GB,A,1 215 858 (MERCK & CO. INC.) 16 December 1970 see example 28 ---	1-4,7,8
X	GB,A,1 080 246 (TWYFORD LABORATORIES LIMITED) 23 August 1967 see the whole document ---	1-4,7,8
A	EP,A,0 370 332 (BAYER AG) 30 May 1990 see the whole document ---	1-8
A	US,A,3 338 913 (J. YATES ET AL.) 29 August 1967 cited in the application see the whole document -----	1-8

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/01507

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO-A-9324472	09-12-93	AU-B- 657413	09-03-95
		AU-B- 4089593	30-12-93
		CA-A- 2112987	09-12-93
		EP-A- 0600092	08-06-94
		JP-A- 6065222	08-03-94

WO-A-9322303	11-11-93	AU-B- 4261293	29-11-93
		CN-A- 1083475	09-03-94
		EP-A- 0637304	08-02-95

WO-A-9314077	22-07-93	AU-B- 3351293	03-08-93
		EP-A- 0623120	09-11-94
		JP-T- 7503459	13-04-95
		ZA-A- 9300377	29-11-93

EP-A-0537980	21-04-93	AU-A- 2689292	21-05-93
		CN-A- 1073433	23-06-93
		WO-A- 9308181	29-04-93
		EP-A- 0609282	10-08-94
		JP-T- 7500327	12-01-95
		ZA-A- 9207955	13-08-93

EP-A-0542363	19-05-93	AP-A- 330	30-03-94
		AU-A- 2915892	15-06-93
		CN-A- 1073169	16-06-93
		WO-A- 9310091	27-05-93
		EP-A- 0612313	31-08-94
		JP-T- 7501063	02-02-95
		ZA-A- 9208768	09-08-93

WO-A-9009381	23-08-90	AU-B- 640637	02-09-93
		AU-A- 5181590	26-09-90
		EP-A- 0457803	27-11-91
		GR-A- 90100077	28-06-91
		IL-A- 93271	11-11-94
		JP-T- 4503212	11-06-92
		WO-A- 9009801	07-09-90
		US-A- 5124342	23-06-92

EP-A-0384362	29-08-90	AU-B- 633872	11-02-93

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(Information on patent family members)

International Application No.

PCT/EP 95/01507

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP-A-0384362		AU-A- 4994090	20-09-90
		CA-A- 2008116	23-08-90
		IL-A- 93422	28-11-94
		JP-B- 6062672	17-08-94
		RU-C- 2024549	15-12-94
JP-A-02193994	31-07-90	NONE	
US-A-5204352	20-04-93	NONE	
JP-A-59225172	18-12-84	NONE	
JP-A-79067419		NONE	
US-A-4515791	07-05-85	NONE	
EP-A-0052442	26-05-82	AU-A- 7709181	20-05-82
		CA-A- 1176250	16-10-84
		JP-A- 62030771	09-02-87
		JP-A- 62036370	17-02-87
		JP-A- 57109771	08-07-82
		US-A- 4423045	27-12-83
		US-A- 4503054	05-03-85
		US-A- 4587246	06-05-86
		US-A- 4683232	28-07-87
US-A-4112095	05-09-78	AT-B- 361495	10-03-81
		AT-B- 360034	10-12-80
		AU-B- 513760	18-12-80
		AU-A- 2899577	29-03-79
		CA-A- 1080712	01-07-80
		DE-A- 2741763	23-03-78
		FR-A- 2442848	27-06-80
		GB-A- 1589237	07-05-81
		JP-A- 53040798	13-04-78
		LU-A- 78150	23-01-78
		NL-A- 7710389	28-03-78
DE-A-2162439	20-06-73	NONE	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/01507

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
DE-A-2204767	09-08-73	NONE	
GB-A-1215858	16-12-70	NONE	
GB-A-1080246		NONE	
EP-A-0370332	30-05-90	DE-A- 3839480	31-05-90
		DE-D- 58907343	05-05-94
		JP-A- 2184675	19-07-90
		US-A- 5006148	09-04-91
US-A-3338913	29-08-67	BE-A- 612252	
		BE-A- 628299	
		CH-A- 425330	
		DE-B- 1276402	
		FR-E- 86953	13-07-66
		FR-A- 1421215	09-03-66
		GB-A- 987253	
		NL-A- 273219	
		US-A- 3318681	09-05-67

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01507

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 6 C07D249/10 A01N43/00 C07D471/04 C07D239/54 C07D239/56
C07D207/452 C07D209/48 C07D211/88 C07D231/56 C07D487/04

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 C07D A01N C07C

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO,A,93 24472 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 9. Dezember 1993 siehe Seite 72, 1. Verbindung ---	1-4,7,8
X	WO,A,93 22303 (GLAXO GROUP LIMITED) 11. November 1993 siehe Seite 11, Formel II, Seiten 34, 35 und 42, Zwischenprodukte 10 und 30 ---	1-4,7,8
X	WO,A,93 14077 (GLAXO GROUP LIMITED) 22. Juli 1993 siehe Seite 13, formel II, sowie Zwischenprodukte 6, 24, 41, 47, 49, 51, 54, 56, 58, 61 und 64 --- -/--	1-4,7,8



Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen



Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

- * "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- * "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- * "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- * "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- * "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

* "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

* "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden

* "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung, die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderscher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

* "A" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

2

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
13. Juli 1995	21. 07. 95
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tlx. 31 651 epo nl, Fax (+ 31-70) 340-3016	Bevollmächtigter Bediensteter Allard, M

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	EP,A,0 537 980 (GLAXO GROUP LIMITED) 21. April 1993 siehe Seite 4, Formel II, sowie Zwischenprodukte 16, 17 und 19 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 542 363 (GLAXO GROUP LIMITED) 19. Mai 1993 siehe Seite 7, Formel II, sowie Zwischenprodukte 10, 17, 25 und 32 ---	1-4,7,8
X	WO,A,90 09381 (ABBOTT LABORATORIES) 23. August 1990 siehe Seite 20, Verbindung 21, sowie Beispiel 21 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 384 362 (F. HOFFMANN-LA ROCHE AG) 29. August 1990 siehe Beispiel 30c ---	1-4,7,8
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 114, no. 1, 7. Januar 1991, Columbus, Ohio, US; abstract no. 6530s, Seite 646 ; siehe Zusammenfassung & JP,A,02 193 994 (KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.) & CHEM. ABS. 12TH COLL. IND. CHEM. SUBST. Seite 10864CS siehe mittlere Spalte, letzte Verbindung, und linke Spalte, erste Verbindung ---	1-4,7,8
X	US,A,5 204 352 (R.J. SUNDBERG ET AL.) 20. April 1993 siehe Spalten 11, 12, Verbindung BK11743 ---	1-4,7,8
X	JOURNAL OF HETEROCYCLIC CHEMISTRY, Bd.25, Nr.1, Januar 1988, PROVOH US Seiten 129 - 137 R.J. SUNDBERG ET AL. 'Preparation of 2-aryl and 2-aryloxymethyl imidazo[1,2-a]pyridines and related compounds' siehe Seite 130, Verbindung 3an ---	1-4,7,8
X	JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, Bd.30, Nr.6, Juni 1987, WASHINGTON US Seiten 1023 - 1029 I. SIRCAR ET AL. 'Cardiotonic agents. 5. 1,2-Dihydro-5[4-(1H-imidazol-1-yl)phenyl]- 6-methyl-2-oxo-3-pyridinecarbonitriles and related compounds. Synthesis and inotropic activity' siehe Seite 1025, Verbindung 18 ---	1-4,7,8

-/--

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte. nales Aktenzeichen
PCT/EP 95/01507

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 103, no. 9, 2. September 1985, Columbus, Ohio, US; abstract no. 71307m, Seite 652 ; siehe Zusammenfassung & JP,A,59 225 172 (YAMANOUCI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) & CHEM. ABS. 11TH COLL. IND. CHEM. SUBST. Seite 7859CS siehe mittlere Spalte, zweite Verbindung ---	1-4,7,8
X	CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 91, no. 22, 26. November 1979, Columbus, Ohio, US; abstract no. 184919q, Seite 646-647 ; siehe Zusammenfassung & JP,A,79 067 419 (KONISHIROKU PHOTO INDUSTRY CO., LTD.) ---	1-4,7,8
X	US,A,4 515 791 (G.R. ALLEN JR. ET AL.) 7. Mai 1985 siehe Beispiel 3 ---	1-4,7,8
X	EP,A,0 052 442 (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES PLC) 26. Mai 1982 siehe Beispiel 40 ---	1-4,7,8
X	US,A,4 112 095 (G.R. ALLEN JR. ET AL.) 5. September 1978 siehe Beispiel 14 ---	1-4,7,8
X	DE,A,21 62 439 (BADISCHE ANILIN- UND SODA-FABRIK AG) 20. Juni 1973 siehe Beispiel 4, Ausgangsverbindung ---	1-4,7,8
X	DE,A,22 04 767 (HENKEL & CIE, GMBH) 9. August 1973 siehe Seite 5, Formel 15, sowie Seiten 20 und 23 ---	1-4,7,8
X	GB,A,1 215 858 (MERCK & CO. INC.) 16. Dezember 1970 siehe Beispiel 28 ---	1-4,7,8
X	GB,A,1 080 246 (TWYFORD LABORATORIES LIMITED) 23. August 1967 siehe das ganze Dokument ---	1-4,7,8
A	EP,A,0 370 332 (BAYER AG) 30. Mai 1990 siehe das ganze Dokument ---	1-8
A	US,A,3 338 913 (J. YATES ET AL.) 29. August 1967 in der Anmeldung erwähnt siehe das ganze Dokument -----	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Intern. Aktenzeichen

PCT/EP 95/01507

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO-A-9324472	09-12-93	AU-B- 657413	09-03-95
		AU-B- 4089593	30-12-93
		CA-A- 2112987	09-12-93
		EP-A- 0600092	08-06-94
		JP-A- 6065222	08-03-94
WO-A-9322303	11-11-93	AU-B- 4261293	29-11-93
		CN-A- 1083475	09-03-94
		EP-A- 0637304	08-02-95
WO-A-9314077	22-07-93	AU-B- 3351293	03-08-93
		EP-A- 0623120	09-11-94
		JP-T- 7503459	13-04-95
		ZA-A- 9300377	29-11-93
EP-A-0537980	21-04-93	AU-A- 2689292	21-05-93
		CN-A- 1073433	23-06-93
		WO-A- 9308181	29-04-93
		EP-A- 0609282	10-08-94
		JP-T- 7500327	12-01-95
		ZA-A- 9207955	13-08-93
EP-A-0542363	19-05-93	AP-A- 330	30-03-94
		AU-A- 2915892	15-06-93
		CN-A- 1073169	16-06-93
		WO-A- 9310091	27-05-93
		EP-A- 0612313	31-08-94
		JP-T- 7501063	02-02-95
		ZA-A- 9208768	09-08-93
WO-A-9009381	23-08-90	AU-B- 640637	02-09-93
		AU-A- 5181590	26-09-90
		EP-A- 0457803	27-11-91
		GR-A- 90100077	28-06-91
		IL-A- 93271	11-11-94
		JP-T- 4503212	11-06-92
		WO-A- 9009801	07-09-90
		US-A- 5124342	23-06-92
EP-A-0384362	29-08-90	AU-B- 633872	11-02-93

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01507

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP-A-0384362		AU-A- 4994090	20-09-90
		CA-A- 2008116	23-08-90
		IL-A- 93422	28-11-94
		JP-B- 6062672	17-08-94
		RU-C- 2024549	15-12-94
JP-A-02193994	31-07-90	KEINE	
US-A-5204352	20-04-93	KEINE	
JP-A-59225172	18-12-84	KEINE	
JP-A-79067419		KEINE	
US-A-4515791	07-05-85	KEINE	
EP-A-0052442	26-05-82	AU-A- 7709181	20-05-82
		CA-A- 1176250	16-10-84
		JP-A- 62030771	09-02-87
		JP-A- 62036370	17-02-87
		JP-A- 57109771	08-07-82
		US-A- 4423045	27-12-83
		US-A- 4503054	05-03-85
		US-A- 4587246	06-05-86
		US-A- 4683232	28-07-87
US-A-4112095	05-09-78	AT-B- 361495	10-03-81
		AT-B- 360034	10-12-80
		AU-B- 513760	18-12-80
		AU-A- 2899577	29-03-79
		CA-A- 1080712	01-07-80
		DE-A- 2741763	23-03-78
		FR-A- 2442848	27-06-80
		GB-A- 1589237	07-05-81
		JP-A- 53040798	13-04-78
		LU-A- 78150	23-01-78
		NL-A- 7710389	28-03-78
DE-A-2162439	20-06-73	KEINE	

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01507

Im Recherchenbericht angeführtes Patentedokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
DE-A-2204767	09-08-73	KEINE	
GB-A-1215858	16-12-70	KEINE	
GB-A-1080246		KEINE	
EP-A-0370332	30-05-90	DE-A- 3839480	31-05-90
		DE-D- 58907343	05-05-94
		JP-A- 2184675	19-07-90
		US-A- 5006148	09-04-91
US-A-3338913	29-08-67	BE-A- 612252	
		BE-A- 628299	
		CH-A- 425330	
		DE-B- 1276402	
		FR-E- 86953	13-07-66
		FR-A- 1421215	09-03-66
		GB-A- 987253	
		NL-A- 273219	
		US-A- 3318681	09-05-67